



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **113062** (13) **C2**  
(51) МПК  
**A01N 43/54** (2006.01)  
**A61K 31/505** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

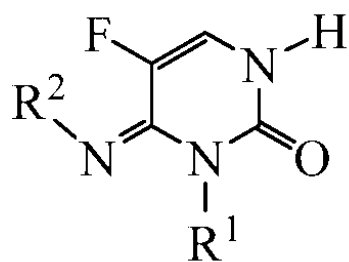
**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

<b>(21)</b> Номер заявки: <b>а 2014 02588</b>	<b>(72)</b> Винахідник(и): <b>Бьобель Тімоті А. (US),</b> <b>Лорсбах Бет (US),</b> <b>Оуен У. Джон (US),</b> <b>Салленбергер Майкл Т. (US),</b> <b>Вебстер Джеффри Д. (US),</b> <b>Яо Ченлінь (US),</b> <b>Гелліфорд Кріс В. (US)</b>
<b>(22)</b> Дата подання заявки: <b>15.08.2012</b>	<b>(73)</b> Власник(и): <b>ДАУ АГРОСАЙЄНСІЗ ЕЛЕЛСІ,</b> 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268, United States of America (US)
<b>(24)</b> Дата, з якої є чинними права на винахід: <b>12.12.2016</b>	<b>(74)</b> Представник: <b>Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115</b>
<b>(31)</b> Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: <b>61/524,506</b>	<b>(56)</b> Перелік документів, взятих до уваги експертизою: BERA, SANJIB ET AL., "Nucleosides with furanyl scaffolds", TETRAHEDRON , 58(24), 4865-4871 CODEN: TETRAB; ISSN: 0040-4020, (2002), doi:10.1016/S0040-4020(02)00430-1 10.1016/S0040-4020(02)00430-1 DUSCHINSKY R. ET AL., "Nucleosides.", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY., USAMERICAN CHEMICAL SOCIETY. WASHINGTON., (1996), vol. 9, no. 4, ISSN 0022-2623, PAGE 566-572, XP002736656 [X] 1 Table IV; second compound; N3-pToluoyl-FC US 2011/0034493 A1, 10.02.2011 US 6 617 330 B2, 09.09.2003 WO 2009/094442 A2, 30.07.2009 WO 2011/043876 A1, 14.04.2011 WO 2011/017540 A1, 10.02.2011 WO 2011/017538 A1, 10.02.2011
<b>(32)</b> Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: <b>17.08.2011</b>	
<b>(33)</b> Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: <b>US</b>	
<b>(41)</b> Публікація відомостей про заявку: <b>25.06.2014, Бюл.№ 12</b>	
<b>(46)</b> Публікація відомостей про видачу патенту: <b>12.12.2016, Бюл.№ 23</b>	
<b>(86)</b> Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: <b>PCT/US2012/050930, 15.08.2012</b>	

**(54) ПОХІДНІ 5-ФТОР-4-ІМІНО-3-(ЗАМІЩЕНОГО)-3,4-ДИГІДРОПІРИМІДИН-2(1Н)ОНУ****(57) Реферат:**

Даний винахід стосується сполук 5-фтор-4-іміно-3-(заміщених)-3,4-дигідропіримідин-2(1Н)онів і їх похідних, а також використання цих сполук як фунгіцидів.

**UA 113062 C2**



Формула I

Перехресне посилання на споріднені заявки

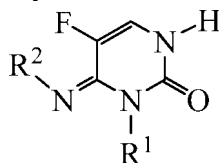
Дана заявка заявляє пріоритет попередньої патентної заявки США № 61/524506, поданої 17 серпня 2011 р., яка включається в даний документ за допомогою посилання.

Рівень техніки і суть винаходу

- 5 Фунгіциди являють собою сполуки природного або синтетичного походження, які своєю дією захищають і/або лікують сільськогосподарські рослини від пошкоджень, що викликаються відповідними грибами. Як правило, жоден фунгіцид не може виявлятися корисним при індивідуальному застосуванні у всіх ситуаціях. Відповідно, продовжуються дослідження з метою отримання фунгіцидів, які можуть відрізняти більш висока ефективність, простота
- 10 застосування і менша вартість.

Даний винахід стосується сполук типу 3-алкіл-5-фтор-4-іміно-3,4-дигідропіримідин-2(1H)ону і їх використання як фунгіцидів. Сполуки згідно з даним винаходом здатні забезпечувати захист від аскоміцетів, базидіоміцетів, дейтероміцетів і ооміцетів.

Один варіант здійснення даного винаходу може включати сполуки формули I:



Формула I

15

в якій  $R^1$  являє собою:

$C_1$ - $C_6$ -алкіл, який необов'язково містить як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^3$ ;

$C_1$ - $C_6$ -алкеніл, який необов'язково містить як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^3$ ;

$C_3$ - $C_6$ -алкініл, який необов'язково містить як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^3$ ;

- 20 феніл або бензил, причому кожний феніл або бензил може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ , або систему з 5- або 6-членних насичених або ненасичених кілець, або конденсовану систему з 5- і 6-членних кілець, або конденсовану систему з 6-6-членних кілець, причому кожна система містить від 1 до 3 гетероатомів, і кожне кільце може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ ,

25  $-(CHR^5)_mOR^6$ ;

$-C(=O)R^7$ ;

$-C(=S)R^7$ ;

$-C(=O)OR^7$ ;

$-C(=S)OR^7$ ;

30  $-S(O)_2R^7$ ;

$-(CHR^5)_mN(R^8)R^9$ ;

$-C(=O)N(R^8)R^9$ ; або

$-C(=S)N(R^8)R^9$ ;

в якій  $m$  являє собою ціле число від 1 до 3;

35  $R^2$  являє собою:

H; або

$C_1$ - $C_6$ -алкіл, який необов'язково містить як замісник радикал  $R^3$ ;

$R^3$  незалежно являє собою галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_4$ -алкілтіо,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілтіо, аміно, галогентіо,  $C_1$ - $C_3$ -алкіламіно,  $C_2$ - $C_6$ -алкоксикарбоніл,  $C_2$ - $C_6$ -алкілкарбоніл,  $C_2$ - $C_6$ -алкіламінокарбоніл, гідроксил,  $C_3$ - $C_6$ -триалкілсиліл, або систему з 5- або 6-членних насичених або ненасичених кілець, або конденсовану систему з 5- і 6-членних кілець, або конденсовану систему з 6-6-членних кілець, причому кожна система містить від 1 до 3 гетероатомів і кожне кільце може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R$ ;

- 45  $R^4$  незалежно являє собою галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_6$ -алкілтіо,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілтіо, галогентіо, аміно,  $C_1$ - $C_6$ -алкіламіно,  $C_2$ - $C_6$ -діалкіламіно,  $C_2$ - $C_6$ -алкоксикарбоніл,  $C_1$ - $C_6$ -алкілсульфоніл або  $C_2$ - $C_6$ -алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціано;

- 50  $R^5$  являє собою H,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси, феніл або бензил, причому кожний феніл або бензил може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ ;

$R^6$  являє собою H,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_2$ - $C_6$ -алкеніл,  $C_3$ - $C_6$ -алкініл,  $C_1$ - $C_6$  галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксіалкіл,  $C_2$ - $C_6$ -алкілкарбоніл, феніл або бензил, причому кожний феніл або бензил може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ , або систему з 5- або 6-членних

насичених або ненасичених кілець, або конденсовану систему з 5- і 6-членних кілець, або конденсовану систему з 6-6-членних кілець, причому кожна система містить від 1 до 3 гетероатомів і кожне кільце може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ , біфеніл або нафтил, що необов'язково містить як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ ;

5  $R^7$  являє собою  $H$ ,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_2$ - $C_6$ -алкеніл,  $C_3$ - $C_6$ -алкініл,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксіалкіл, феніл або бензил, причому кожний феніл або бензил може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ , або систему з 5- або 6-членних насичених або ненасичених кілець, або конденсовану систему з 5- і 6-членних кілець, або конденсовану систему з 6-6-членних кілець, причому кожна система містить від 1 до 3 гетероатомів і кожне кільце може

10 необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ , біфеніл або нафтил, що необов'язково містить як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ ;

$R^8$  являє собою  $H$ ,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксіалкіл,  $C_2$ - $C_6$ -алкілкарбоніл, феніл або бензил, причому кожний феніл або бензил може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ , або систему з 5- або 6-членних насичених або ненасичених кілець, або конденсовану систему з 5- і 6-членних кілець, або конденсовану систему з 6-6-членних кілець, причому кожна система містить від 1 до 3 гетероатомів і кожне кільце може необов'язково

15 містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ , біфеніл або нафтил, що необов'язково містить як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ ; і  $R^9$  являє собою  $H$ ,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксіалкіл,  $C_2$ - $C_6$ -алкілкарбоніл, або бензил, причому бензил може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ ;

20 як альтернатива,  $R^8$  і  $R^9$  можуть спільно утворювати 6- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить від 1 до 3 гетероатомів, причому кожне кільце може необов'язково містити як замісники від 1 до 3 радикалів  $R^4$ .

Ще один варіант здійснення даного винаходу може включати фунгіцидну композицію для

25 боротьби з або запобігання грибковим захворюванням, що містить сполуки, описані нижче, і фітологічно прийнятний матеріал носія.

Наступний варіант здійснення даного винаходу може включати спосіб боротьби з або запобігання грибковим захворюванням рослин, причому даний спосіб включає стадію нанесення фунгіцидно ефективної кількості однієї або декількох сполук, описаних нижче

30 щонайменше на один з наступних об'єктів: гриб, рослина, ділянка навколо рослини і насіння, призначене для вирощування рослини.

Термін "алкіл" означає розгалужений, нерозгалужений або циклічний вуглецевий ланцюг, в тому числі метил, етил, пропіл, бутіл, ізопропіл, ізобутіл, трет-бутіл, пентил, гексил, циклопропіл, циклобутіл, циклопентил, циклогексил і т. п.

35 Термін "алкеніл" означає розгалужений, нерозгалужений або циклічний вуглецевий ланцюг, що містить один або декілька подвійних зв'язків, в тому числі етеніл, пропеніл, бутеніл, ізопропеніл, ізобутеніл, циклогексеніл і т. п.

Термін "алкініл" означає розгалужений або нерозгалужений вуглецевий ланцюг, що містить один або декілька потрійних зв'язків, в тому числі пропініл, бутиніл і т. п.

40 При використанні у всьому тексті даної заявки термін "R" означає групу, яку складають  $C_{1-8}$ -алкіл,  $C_{3-8}$ -алкеніл або  $C_{3-8}$ -алкініл, якщо не визначена інша умова.

Термін "алкокси" означає -OR як замісник.

Термін "алкоксикарбоніл" означає -C(O)-OR як замісник.

Термін "алкілкарбоніл" означає -C(O)-R як замісник.

45 Термін "алкілсульфоніл" означає -SO<sub>2</sub>-R як замісник.

Термін "алкілтіо" означає -S-R як замісник.

Термін "галогентіо" означає атом сірки, до якого приєднані три або п'ять атомів F, як замісники.

Термін "галогеналкілтіо" означає алкілтіогрупу, яка містить як замісники атоми Cl, F, I або Br або будь-яке їх сполучення.

50 Термін "алкіламінокарбоніл" означає -C(O)-N(H)-R як замісник.

Термін "триалкілсиліл" означає -SiR<sub>3</sub>.

Термін "ціано" означає -C≡N як замісник.

Термін "гідроксил" означає -OH як замісник.

Термін "аміно" означає -NH<sub>2</sub> як замісник.

55 Термін "алкіламіно" означає -N(H)-R як замісник.

Термін "диалкіламіно" означає -NR<sub>2</sub> як замісник.

Термін "алкоксіалкіл" означає алкоксизаміщений алкіл.

Термін "галоген" або "гало" означає один або декілька атомів галогенів, визначених як F, Cl, Br і I.

60 Термін "нітро" означає -NO<sub>2</sub> як замісник.

У всьому тексті даного опису згадку сполук формули I потрібно розглядати як таку, що включає також оптичні ізомери і солі формули I і відповідні гідрати. Зокрема, коли формула I містить алкільну групу з розгалуженим ланцюгом, мається на увазі, що такі сполуки включають відповідні оптичні ізомери і рацемати. Зразкові солі включають гідрохлорид, гідробромід, гідройодид і т. п. Крім того, сполуки формули I можуть включати таутомерні форми.

Певні сполуки, описані в цьому документі, можуть існувати в формі одного або декількох ізомерів. Фахівці в даній галузі техніки розуміють, що один ізомер може бути більш активним, ніж інші. Структури, описані в цьому документі, для ясності представлені на кресленнях тільки в одній геометричній формі, але мається на увазі представлення всіх геометричних і таутомерних молекулярних форм.

Крім того, фахівці в даній галузі техніки розуміють, що додаткове заміщення є допустимим, якщо не визначене інше, при тій умові, що виконуються всі правила утворення хімічних зв'язків і енергії деформації, і продукт все ж виявляє фунгіцидну активність.

Ще один варіант здійснення даного винаходу являє собою використання сполуки формули I для захисту рослин від впливу фітопатогенних організмів або для лікування рослин, уражених фітопатогенними організмами, яке включає нанесення сполуки формули I або композиції, що містить дану сполуку, на ґрунт, рослину, частину рослини, листя і/або насіння.

Крім того, ще один варіант здійснення даного винаходу являє собою композицію, яку можна використовувати для захисту рослин від впливу фітопатогенних організмів і/або для лікування рослин, уражених фітопатогенними організмами, яка містить сполуку формули I і фітологічно прийнятний матеріал носія.

Додаткові відмітні особливості і переваги даного винаходу стануть очевидними для фахівців в даній галузі техніки після ознайомлення з наступним докладним описом ілюстративних варіантів здійснення, які представляють приклади найкращих способів реалізації даного винаходу, які відомі в даний час.

Докладний опис винаходу

Сполуки згідно з даним винаходом можна використовувати будь-яким з різноманітних відомих способів, в тому числі в формі чистих сполук або в формі композицій, які містять дані сполуки. Наприклад, сполуки можна наносити на коріння, насіння або листя рослин для боротьби з різноманітними грибами, не зменшуючи товарної цінності рослин. Матеріали можна використовувати в формі композицій будь-яких типів, що звичайно застосовуються, наприклад, таких як розчини, дрібні порошки, змочувані порошки, сипкі концентрати або емульговані концентрати.

Переважно, сполуки згідно з даним винаходом використовують в формі композиції, що включає одну або декілька сполук формули I і фітологічно прийнятний носій. Концентровані композиції можна диспергувати у воді або інших рідинах для застосування, або композиції можна використовувати в формі дрібного порошку або гранул, які потім можна застосовувати без додаткової обробки. Композиції можна виготовляти згідно з процедурами, які традиційно використовуються в галузі сільськогосподарської хімії.

Даний винахід поширюється на всі носії, з якими одну або декілька сполук можна об'єднувати в композиції для доставки і використання як фунгіциду. Як правило, композиції використовують в формі водних суспензій або емульсій. Такі суспензії або емульсії можна виготовляти, використовуючи розчинні у воді, суспендовані у воді або емульговані композиції, які являють собою тверді речовини, звичайно відомі як змочувані порошки, або рідини, звичайно відомі як емульговані концентрати, водні суспензії або суспензійні концентрати. Як можна легко зрозуміти, можна використовувати будь-який матеріал, до якого можна додавати дані сполуки, при тій умові, що він забезпечує бажане застосування, не чинячи значного впливу на активність цих сполук як протигрибкових речовин.

Змочувані порошки, які можна ущільнювати, утворюючи дисперговані у воді гранули, включають однорідну суміш однієї або декількох сполук формули I, інертного носія і поверхнево-активних речовин. Концентрація сполуки в змочуваному порошку може становити від приблизно 10 мас.% до приблизно 90 мас.% до, переважніше від приблизно 25 мас.% до приблизно 75 мас.% відносно сумарної маси змочуваного порошку. При виготовленні композицій, яка містить незмочуваний порошок, сполуки можна поєднувати з будь-якими тонкоподрібненими твердими матеріалами, такими як пірофіліт, тальк, крейда, гіпс, фулерова земля, бентоніт, атапульгіт, крохмаль, казеїн, глютен, монтморилонітові глини, діатомові землі, очищені силікати і т. п. В таких операціях тонкоподрібнений носій і поверхнево-активні речовини, як правило, змішують зі сполукою (сполуками) і піддають розмелюванню.

Емульговані концентрати сполук формули I можуть включати відповідну концентрацію, яка становить, наприклад, від приблизно 10 мас.% до приблизно 50 мас.% сполуки, у прийнятній

рідині, відносно сумарної маси концентрату. Сполуки можна розчиняти в інертному носії, який являє собою розчинник, що змішується з водою, або суміш органічних розчинників, що не змішуються з водою, і емульгаторів. Концентрати можна розбавляти водою і маслом, отримуючи розпилювані суміші в формі емульсій масло-в-воді. Використовувані органічні

5 розчинники включають ароматичні сполуки, зокрема, що мають високу температуру кипіння нафталінові і олефінові фракції нафти, такі як важкий лігроїн, збагачений ароматичними сполуками. Можна також використовувати і інші органічні розчинники, наприклад, терпенові розчинники, що включають похідні каніфолі, аліфатичні кетони, такі як циклогексанон, і складні спирти, такі як 2-етоксіетанол.

10 Емульгатори, які можна переважно використовувати в цьому документі, і які можуть легко визначати фахівці в даній галузі, включають різноманітні неіонні, аніонні, катіонні і амфотерні емульгатори, або суміш двох або більше емульгаторів. Приклади неіонних емульгаторів, що використовуються для виготовлення емульгованих концентратів, включають прості ефіри поліалкіленгліколю і продукти конденсації алкіл- і арилфенолів, аліфатичних спиртів,

15 аліфатичних амінів або жирних кислот з етиленоксидом і пропіленоксидом, такі як етоксировані алкілфеноли і складні ефіри карбонових кислот, солюбілізовані багатоатомним спиртом або поліоксіалкіленом. Катіонні емульгатори включають сполуки четвертинного амонію і солі жирних амінів. Аніонні емульгатори включають розчинні в маслі солі (наприклад, солі кальцію) алкіларилсульфонових кислот, розчинні в маслі солі або сульфатовані прості

20 ефіри полігліколю і відповідні солі фосфатованих простих ефірів полігліколю.

Зразкові приклади органічних рідин, які можна використовувати у виготовленні емульгованих концентратів сполук згідно з даним винаходом, являють собою рідкі ароматичні сполуки, такі як фракції ксилолу і пропілбензолу; або змішані нафталінові фракції, мінеральні масла, рідкі заміщені органічні ароматичні сполуки, такі як діоктилфталат; гас; діалкіламіді різноманітних

25 жирних кислот, зокрема, диметиламіді жирних гліколів і похідні гліколів, такі як н-бутиловий ефір, етиловий ефір або метиловий ефір діетиленгліколю, метиловий ефір триетиленгліколю, фракції нафти або вуглеводні, такі як мінеральні масла, ароматичні розчинники, парафінові масла і т. п.; рослинні олії, такі як соєва олія, ріпакова олія, оливкова олія, рицинова олія, соняшникова олія, кокосова олія, кукурудзяна олія, бавовняна олія, льняна олія, пальмова олія,

30 арахісова олія, сафлорова олія, кунжутна олія, тунгова олія і т. п.; складні ефіри вищезазначених рослинних олій і т. п. Можна також використовувати суміші двох або більше органічних рідин у виготовленні емульгованого концентрату. Органічні рідини включають фракції ксилолу і пропілбензолу, причому ксилол є найбільш переважним в деяких випадках. Поверхнево-активні диспергуючі речовини, як правило, використовують в рідких композиціях в кількості, що становить від 0,1 до 20 мас.% відносно сумарної маси диспергуючої речовини і

35 однієї або декількох сполук. Композиції можуть також містити інші сумісні добавки, наприклад, регулятори росту рослин і інші біологічно активні сполуки, що використовуються в сільському господарстві.

Водні суспензії включають суспензії однієї або декількох нерозчинних у воді сполук формули I, диспергованих у водному носії в концентрації, що становить від приблизно 5 мас.% до

40 приблизно 50 мас.%, відносно сумарної маси водної суспензії. Суспензії виготовляють, тонко подрібнюючи одну або декілька сполук і інтенсивно перемішуючи подрібнений матеріал з носієм, що містить воду і поверхнево-активні речовини, вибрані з таких же типів, які обговорюються вище. Інші компоненти, такі як неорганічні солі і синтетичні або натуральні смоли, можна також додавати, щоб збільшувати густину і в'язкість водного носія. Часто виявляється найбільш ефективним одночасне здійснення подрібнення і змішування за допомогою виготовлення водної суміші і її гомогенізації в такому пристрої, як піщаний млин, кульовий млин або гомогенізатор поршневого типу.

Водні емульсії включають емульсії одного або декількох нерозчинних у воді інгредієнтів, які

50 мають пестицидну активність, емульгованих у водному носії в концентрації, що становить, як правило, від приблизно 5 до приблизно 50 мас.% відносно сумарної маси водної емульсії. Якщо інгредієнт, який має пестицидну активність, є твердим, його необхідно розчиняти у відповідному розчиннику, що не змішується з водою, перед виготовленням водної емульсії. Емульсії виготовляють, емульгуючи рідкий інгредієнт, який має пестицидну активність, або його розчин,

55 що не змішується з водою, і водне середовище, як правило, з додаванням поверхнево-активних речовин, які сприяють утворенню і стабілізації емульсії, як описано вище. Це часто здійснюють за допомогою інтенсивного перемішування, яке забезпечують високошвидкісні змішувачі або гомогенізатори.

Сполуки формули I можна також використовувати в формі гранульованих композицій, які є

60 особливо корисними при нанесенні на ґрунт. Гранульовані композиції, як правило, містять від

приблизно 0,5 до приблизно 10 мас.% (відносно сумарної маси гранульованої композиції) сполуки (сполук), які диспергують в інертному носії, який складається повністю або в більшій частині з грубоподрібненого інертного матеріалу, такого як атапульгіт, бентоніт, діатоміт, глина або аналогічна речовина, що недорого коштує. Такі композиції звичайно виготовляють шляхом розчинення сполук у відповідному розчиннику і нанесення розчину на гранульований носій, який виготовляють завчасно, отримуючи частинки відповідного розміру, що становить від приблизно 0,5 мм до приблизно 3 мм. Прийнятний розчинник являє собою розчинник, в якому дана сполука є добре або повністю розчинною. Такі композиції можна також виготовляти шляхом змішування тістоподібної маси або пасти, яка містить носій, сполуку і розчинник, і її подрібнення і сушіння для отримання бажаних гранульованих частинок.

Дрібні порошки, що містять сполуки формули I, можна виготовляти шляхом ретельного перемішування однієї або декількох сполук в порошкоподібній формі з прийнятним тонкоподрібненим носієм, що використовується в сільському господарстві, таким як, наприклад, каолінова глина, мелена вулканічна порода і т. п. Відповідні дрібні порошки можуть містити від приблизно 1 до приблизно 10 мас.% сполук відносно сумарної маси дрібного порошку.

Композиції можуть додатково містити допоміжні поверхнево-активні речовини, які сприяють нанесенню, змочуванню і проникненню сполук в цільові культурні рослини і шкідливі організми. Ці допоміжні поверхнево-активні речовини можна необов'язково використовувати як компоненти композиції або як резервуарну суміш. Кількість допоміжної поверхнево-активної речовини, як правило, становить від 0,01 до 1,0 об.%, переважно від 0,05 до 0,5 об.% відносно об'єму розпилюваної води. Прийнятні допоміжні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються цим, етоксировані нонілфеноли, етоксировані синтетичні або натуральні спирти, солі складних ефірів і сульфоянтарних кислот, етоксировані кремнійорганічні сполуки, етоксировані жирні аміни, суміші поверхнево-активних речовин з мінеральними маслами або рослинними оліями, концентрати олій сільськогосподарських рослин (мінеральне масло (85%) + емульгатори (15%)); нонілфенолетоксилат; солі четвертинного бензилкоалкілдиметиламонію; суміш нафтових вуглеводнів, складних алкілфенілів, органічних кислот і аніонної поверхнево-активної речовини; C<sub>9</sub>-C<sub>11</sub>-алкілполіглікозид; фосфатований етоксилат спирту; етоксилат натурального первинного спирту (C<sub>12</sub>-C<sub>16</sub>); блок-співполімер ди-втор-бутилфенолу, етиленоксиду (ЕО) і пропіленоксиду (РО); полісилоксан з метиловою захисною групою; нонілфенолетоксилат + сечовина і нітрат амонію; емульговану метильовану рослинну олію; етоксилат (8ЕО) тридецилового спирту (синтетичний); етоксилат (15 ЕО) амін з радикалом з яловичого жиру; діолеат 99 поліетилегліколю (РЕG) з молекулярною масою 400. Композиції можуть також включати емульсії масло-в-воді, такі як емульсії, описані в патентній заявці США № 11/495228, опис якої визначено включений в цей документ за допомогою посилання.

Композиції можуть необов'язково включати сполучення, в яких містяться інші пестицидні сполуки. Такі додаткові пестицидні сполуки можуть являти собою фунгіциди, інсектициди, гербіциди, нематодциди, акарициди, артроподициди, бактерициди або їх сполучення, які є сумісними зі сполуками згідно з даним винаходом в середовищі, вибраному для застосування, і не протидіє активності сполук згідно з даним винаходом. Відповідно, згідно з такими варіантами здійснення, інші пестицидні сполуки використовують як додаткову отруйну речовину для такого ж або іншого пестицидного застосування. Сполуки формули I і пестицидна сполука в поєднанні можуть бути присутніми в масовому співвідношенні, що становить, як правило, від 1:100 до 100:1.

Сполуки згідно з даним винаходом можна також поєднувати з іншими фунгіцидами, отримуючи фунгіцидні суміші і відповідні синергетичні суміші. Фунгіцидні сполуки згідно з даним винаходом часто використовують в поєднанні з одним або декількома іншими фунгіцидами для лікування більш широкого кола різноманітних небажаних захворювань. При використанні в поєднанні з іншим фунгіцидом (фунгіцидами) сполуки згідно з даним винаходом можна змішувати з іншим фунгіцидом (фунгіцидами), перемішувати в резервуарі з іншим фунгіцидом (фунгіцидами) або застосовувати послідовно з іншим фунгіцидом (фунгіцидами). Такі інші фунгіциди можуть включати 2-(тіоціанатометилтіо)-бензотіазол, 2-фенілфенол, 8-гідроксифінолінсульфат, аметоктрадин, амисульбром, антимицин, виробляючий амеломіцин гриб *Ampelomyces quisqualis*, азаконазол, азоксистробін, сінна паличка (*Bacillus subtilis*), беналаксил, беноміл, бентіавалікарбізопропіл, сіль бензиламінобензолсульфонату (BABS), бікарбонати, біфеніл, бісмертіазол, бітертанол, біксафен, бластицидин-S, бура, бордоська суміш, боскалід, бромукназол, бупіримат, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карпропамід, карвон, хлоронеб, хлороталоніл, клозолінат, гриб *Coniothyrium minitans*, гідроксид міді, октаноат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, (триосновний) сульфат міді, оксид міді(I),

ціазофамід, кіфлуфенамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дазомет, дебакарб,  
 етиленбіс(дитіокарбамат) діамонію, дихлофлуанід, дихлорофен, диклоцимет, дикломезин,  
 дихлоран, диетифенкарб, дифеноконазол, іон 1,2-диметил-3,5-дифеніл-1-піразолін-1-  
 метилсульфат (дифензокват), дифлуметорим, диметоморф, димоксистробін, диніконазол,  
 5 диніконазол-М, динобутон, динокап, дифеніламін, дитіанон, додеморф, додеморф ацетат,  
 додин, вільна основа додину, едифенфос, енестробін, епоксиконазол, етабоксам, етоксикін,  
 етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенексамід,  
 феноксаніл, фенпиклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фенпіразамін, фентин, фентинацетат,  
 10 фентингідроксид, фербам, феримзон, флуазилам, флудіоксоніл, флуморф, флуопіколід,  
 флуопірам, флуороїмід, флуоксастробін, флухінконазол, флусилазол, флусульфамід,  
 флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, флуксапіроксад, фолпет, формальдегід, фозетил,  
 фосетилалюміній, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, гуазатин, гуазатинацетати,  
 тетратіопероксокарбонат натрію (GY-81), гексахлорбензол, гексаконазол, гімексазол, імазаліл,  
 імазалілсульфат, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадинтриацетат,  
 15 іміноктадинтрис(альбездилат), йодокарб, іпконазол, іпфенпіразолон, іпробенфос, іродіон,  
 іпровалікарб, ізопротіолан, ізопіразам, ізотіаніл, ламінарин, касугаміцин, гідрат  
 касугаміцингідрохлориду, крезоксим-метил, манкоппер, манкоцеб, мандипропамід, манеб,  
 мефеноксам, мепаніпірим, мепроніл, мептил-динокап, хлорид ртуті(II), оксид ртуті(II), хлорид  
 ртуті(I), металаксил, металаксил-М, метилдитіокарбамат, метилдитіокарбамат амонію,  
 20 метилдитіокарбамат калію, метилдитіокарбамат натрію, метконазол, метасульфоккарб,  
 метилйодид, метилізотіоціанат, метирам, метоміностробін, метрафенон, мілдіоміцин,  
 мікробутаніл, набам, нітроталізопропіл, нуаримол, октилінон, офурас, олеїнова кислота (жирна  
 кислота), оризастробін, оксаксидил, оксин міді, окспоконазолфумарат, оксикарбоксин,  
 пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенол, пентахлорфеніллаурат,  
 25 пентіопірад, ацетат фенілртуті, фосфоновіа кислота, фталід, пікоксистробін, поліоксин В,  
 поліоксині, поліоксорим, бікарбонат калію, гідроксифінолінсульфат калію, пробеназол,  
 прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарб гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб,  
 прохіназид, протіконазол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос,  
 пірибенкарб, пірибутикарб, пірифенокс, піриметаніл, піріофенон, пірохілон, хінокламін,  
 30 кунеоксифен, хінтозен, екстракт гречки сахалінської (*Reynoutria sachalinensis*), седаксан,  
 силтіофам, симеконазол, 2-фенілфеноксид натрію, бікарбонат натрію, пентахлорфеноксид  
 натрію, спіроксамін, сірка, енестроурин (SYP-Z071), 5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметил-3-(піридин-3-  
 іл)-оксазолін (SYP-Z048), дігтярні масла, тебуконазол, тебуфлуксин, текназен, тетраконазол,  
 тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толілфлуанід,  
 35 триадимефон, триадименол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін,  
 трифлумізол, трифорин, тритиконазол, валідаміцин, валіфеналат, валіфенал, вінклозолін,  
 цинеб, цирам, цоксамід, гриб *Candida oleophila*, гриб *Fusarium oxysporum*, гриби видів роду  
*Glucocladium*, гриб *Phlebiopsis gigantea*, гриб *Streptomyces griseoviridis*, гриби видів роду  
*Trichoderma*, (RS)-N-(3,5-дихлорфеніл)-2-(метоксиметил)-сукцинимід, 1,2-дихлорпропан, 1,3-  
 40 дихлор-1,1,3,3-тетрафторацетонгідрат, 1-хлор-2,4-динітронафталін, 1-хлор-2-нітропропан, 2-(2-  
 гептадецил-2-імідазолін-1-іл)етанол, 2,3-дигідро-5-феніл-1,4-дитіїн-1,1,4,4-тетраоксид, ацетат 2-  
 метоксіетилртуті, хлорид 2-метоксіетилртуті, силікат 2-метоксіетилртуті, 3-(4-хлорфеніл)-5-  
 метилпроданін, 4-(2-нітропроп-1-еніл)фенілтіоціанат, ампропілфос, анілазин, азитирам,  
 полісульфід барію, тріс(1-додецил-3-метил-2-фенілбензімідазолію) гексаціаноферат (Bayer  
 32394), беноданіл, бенхінокс, бенталурон, бензамакрил; бензамакрил-ізобутил, бензаморф,  
 45 бінапакрил, біс(метилртуті) сульфат, біс(трибутилолова) оксид, бутіобат, хромат-сульфат  
 кадмію-кальцію-міді-цинку, карбаморф, ундециленамідпропілбетаїн (CECA), хлобентіазон,  
 хлораніформетан, хлорфеназол, хлорхінокс, клімбазол, циклафурамід, ципендазол,  
 ципрофурам, декафентин, дихлон, дихлозолін, диклобутразол, диметиримол, диноктон,  
 50 диноссульфон, динотербон, дипіритіон, диталімфос, додичин, дразоксолон, S-бензил-О, О-  
 діетилфосфотіолят (EBP), О-етил-S-бензилфенілфосфонотіоат (ESBP), етаконазол, етем,  
 етирим, фенаміносольф, фенапаніл, фенітропан, флуотримазол, фуркарбаніл, фурконазол,  
 цис-фурконазол, фурмециклокс, фуорофанат, гліодин, гризеофульвін, галакринат, 5-хлор-4-  
 феніл-1,2-дитіол-3-он (Hercules 3944), гексилтіофос, N-(6-метокси-3-  
 55 піридиніл)циклопропанкарбоксамід (ICIA 0858), ізопамфос, ізоваледіон, мебеніл, мекарбінзид,  
 метазоксолон, метфуруксам, диціандіамід метилртуті, метсульфовакс, мілнеб, мукохлорний  
 ангідрид, міклозолін, N-3,5-дихлорфенілсукцинимід, N-3-нітрофенілітаконімід, натаміцин, N-  
 етилмеркуріо-4-толуолсульфонанілід, біс(диметилдитіокарбамат) нікелю, 2,3,4,4,5,5,6,6-  
 октахлор-2-циклогексен-1-он (OCH), диметилдитіокарбамат фенілртуті, нітрат фенілртуті,  
 60 фосдифен, піколінамід UK-2A і його похідні, протіокарб, протіокарб гідрохлорид, піракарболід,



піридинітрил, піроксихлор, піроксифур, хінацетол, хінацетолсульфат, хіназамід, хінконазол, рабензазол, саліциланлід, 1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)циклогептан-1-ол (SSF-109), сультропен, текорам, тіадифтор, тиціофен, тіохлорфенфін, тіофанат, тіохінокс, тіоксимид, триаміфос, триаримол, триазбутил, трихлорамід, урбацил, зариламід і будь-які їх

5

сполучення. Крім того, сполуки згідно з даним винаходом можна поєднувати з іншими пестицидами, включаючи інсектициди, нематоциди, акарициди, артроподициди, бактерициди або їх

10

сполучення, які є сумісними зі сполуками згідно з даним винаходом в середовищі, вибраному для застосування, і не протидіють активності сполук згідно з даним винаходом при утворенні пестицидних сумішей і відповідних синергетичних сполучень. Фунгіцидні сполуки згідно з даним винаходом можна застосовувати в поєднанні з одним або декількома іншими пестицидами для боротьби з більш широкою різноманітністю небажаних шкідників. При використанні в поєднанні з іншими пестицидами, сполуки згідно з даним винаходом можна вводити в композиції з іншим пестицидом (пестицидами), перемішувати в резервуарі з іншим пестицидом (пестицидами) або застосовувати послідовно з іншим пестицидом (пестицидами).

15

Типові інсектициди включають, але не обмежуються цим, наступні: 1,2-дихлорпропан, абаментин, ацефат, ацетаміпрід, ацетир, ацетопрол, акринатрин, акрилонітрил, аланікарб, алдікарб, альдоксикарб, алдрин, алетрин, алозамідин, аліксикарб, альфа-циперметрин, альфа-екдизон, альфа-ендосульфат, амідітін, амінокарб, амітон, амітоноксалат, амітраз, анабазин, атидатіон, азадирахтин, азаметифос, азинфос-етил, азинфос-метил, азотоат, гексафторсилікат барію, батрин, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бета-суфлутрин, бета-циперметрин, біфентрин, біоалетрин, біоетанометрин, біоперметрин, бістрифлурон, бура, борна кислота, бромфенвінфос, бромоциклен, бромдихлордифенілтрихлоретан (DDT), бромофос, бромофос-етил, буфенкарб, бупрофезин, бутаккарб, бутатіофос, бутокарбоксим, бутонат,

20

25

бутоксикарбоксим, кадузафос, арсенат кальцію, полісульфід кальцію, камфехлор, карбаноліт, карбарил, карбофуран, сірковуглець, тетрахлорид вуглецю, карбофенотіон, карбосульфат, картап, картап гідрохлорид, хлорантраніліпрол, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, хлордимеформ, хлордимеформ гідрохлорид, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлороформ, хлорпікрин, хлорфоксим, хлорпразофос, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлортіофос, хромафенозид, цинерин I, цинерин II, цинерини, цисметрин, клоетоккарб, клозантел, клотіанідин, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, нафтенат міді, олеат міді, кумафос, сумітоат, кротамітон, кротоксифос, круфомат, кріоліт, ціанофенфос, ціанофос, ціантоат, ціантраніліпрол, циклетрин, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, циперметрин, цифенотрин, циромазин, цитіоат, дихлордифенілтрихлоретан (DDT), декарбофуран, дельтаметрин, деметіон, деметіон-О, деметіон-S, деметон, деметон-метил, деметон-О, деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діафентіурон, діаліфос, діатомова земля, діазинон, дикаптон, дихлофентіон, дихлорвос, дикрезил, дикротофос, дицикланіл, дильдрин, дифлубензурон, дилор, димефлутрин, димефокс, диметан, диметоат, диметрин, диметилвінфос, диметилан, динекс, динекс-диклексин, динопроп, динозам, динотефуран, діофенолан, діоксабензофос, діоксикарб, діоксатіон, дисульфотон, дитикрофос, d-лімонен, динітро-о-крезол (DNOC), динітро-о-крезоліт амонію, динітро-о-крезоліт калію, динітро-о-крезоліт натрію, дорамектин, екмекстерон, емаектин, емаектин бензоат, 4-етилтіофенілметилкарбамат (EMPC), емпентрин, ендосульфат, ендотіон, ендрин, О-етил-О-(4-нітрофеніл)фенілфосфонотіоат (EPN), епофенонан, епріномектин, есдепалетрин, есфенвалерат, етафос, етіофенкарб, етіон, етіпрол, етоат-метил, етопрофос, етилформіат, етил-1-хлор-4-[2,2-дихлор-1-(4-хлорфеніл)етил]бензол (DDD), етилендібромід, етилендихлорид, етиленоксид, етофенпрокс, етримфос, етилксантогендисульфід (EXD), фамфур, фенаміфос, феназафлор, фенхлорфос, фенетаккарб, фенфлутрин, фенітротіон, фенобукарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпіритрин, фенпропатрин, фенсульфотіон, фентіон, фентіон-етил, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флукофуран, флуциклоксурон, флусутринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфенпрокс, флуфіпрол, флувалінат, фонофос, форметанат, форметанат гідрохлорид, формотіон, формпаранат, формпаранат гідрохлорид, фосметилан, фоспірат, фосітетан, фуратіокарб, фуретрин, гамма-цигалотрин, гамма-гексахлорциклогексан (HCH), галфенпрокс, галофенозид, гексахлорциклогексан (HCH), 1,2,3,4,10,10-гексахлоро-6,7-епокси-1,4,4а,5,6,7,8,8а-октагідро-1,4,5,8-диметанонафталін (HEOD), гептахлор, гептенфос, гетерофос, гексафлумурон, гексахлоро-1,4,4а,5,8,8а-гексагідро-1,4-ендо, екзо-5,8-диметанонафталін (HNHN), гідраметилнон, ціаністий водень, гідропрен, гіксинкарб, імідаклопрід, іміпротрин, індоксакарб, йодметан, S-[(етансульфініл)метил]-О,О-ди(пропан-2-іл)фосфордитіоат (IPSP), ізазофос, ізобензан, ізокарбофос, ізодрин, ізофенфос, ізофенфос-метил, ізопрокарб, ізопротіолан,

40

45

50

55

60

ізотіоат, ізоксатіон, івермектин, джасмолін I, джасмолін II, джодфенфос, ювенільний гормон I, ювенільний гормон II, ювенільний гормон III, келеван, кінопрен, лямбда-цигалотрин, арсенат свинцю, лепіметин, лептофос, ліндан, ліримфос, люфенурон, літидатіон, малатіон, малонобен, мазидох, мекарбам, мекарфон, маназон, меперфлутрин, мефосфолан, хлорид ртуті(II),

5 месульфенфос, метафлумізон, метакрифос, метамідофос, метидатіон, метіокарб, метокротофос, метоміл, метопрен, метоксихлор, метоксифенозид, метилбромід, метилізотіоціанат, метилхлороформ, метиленхлорид, метофлутрин, метолкарб, метоксадіазон, мевінфос, мексакарбат, мілбемектин, мілбеміциноксим, міпафокс, мірекс, молосультап, монокротофос, мономегіпо, моносультат, морфотіон, моксидектин, нафталофос, налед,

10 нафталін, нікотин, ніфлуридид, нітенпірам, нитіазин, нітрилакарб, новалурон, новіфлумурон, ометоат, оксаміл, оксидеметон-метил, оксидепрофос, оксидисульфотон, пара-дихлорбензол, паратіон, паратіон-метил, пенфлурон, пентахлорфенол, перметрин, фенкаптон, фенотрин, фентоат, форат, фосалон, фосфолан, фосмет, фосніхлор, фосфамідон, фосфін, фоксим, фоксим-метил, піриметафос, піримікарб, піриміфос-етил, піриміфос-метил, арсенат калію,

15 тіоціанат калію, 1,1,1-трихлор-2,2-ди(п-хлорфеніл) (п,п'-DDT), пралетрин, прекоцен I, прекоцен II, прекоцен III, примідофос, профенофос, профлуралін, промацил, промекарб, пропафос, пропетамфос, пропоксур, протидатіон, протіофос, протоат, протрифенбут, піраклофос, пірафлупрол, піразофос, піресметрин, піретрин I, піретрин II, піретрини, піридабен, піридаліл, піридафентіон, пірифлухіназон, піримідифен, піримітат, пірипрол, пірипроксибен, квасія,

20 хіналфос, хіналфос-метил, хінотіон, рафоксанід, ресметрин, ротенон, ріанію, сабадила, шрадан, селамектин, силафлуофен, силікагель, арсеніт натрію, фторид натрію, гексафторсилікат натрію, тіоціанат натрію, софамід, спінеторам, спіносад, спіромезифен, спіротетрамат, сулькофулон, сулькофулон натрій, сульфлурамід, сульфотеп, сульфоксафлор, фтористий сульфуріл, сульпрофос, тау-флувалінат, тазимкарб, тетрахлордифенілетан (TDE),

25 тебуфенозид, тебуфенпірад, тебупіримфос, тефлубензурон, тефлутрин, темефос, тетраетилдифосфат (TEPP), тералетрин, тербуфос, тетрахлоретан, тетрахлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тета-циперметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тикрофос, тіокарбоксим, тіоциклам, тіоцикламоксалат, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіосультап, динатрійтіосультап, мононатрійтіосультап, турингієнсин, толфенпірад, тралометрин,

30 трансфлутрин, трансперметрин, триаратен, триазамат, триазофос, трихлорфон, трихлорметафос-3, трихлоронат, трифенофос, трифлумурон, триметакарб, трипрен, вамідотіон, ваніліпрол, 3,5-диметилфенілметилкарбамат (ХМС), ксилілкарб, зета-циперметрин, золапрофос і будь-які їх поєднання.

Крім того, сполуки згідно з даним винаходом можна поєднувати з гербіцидами, які є сумісними

35 зі сполуками згідно з даним винаходом в середовищі, вибраному для застосування, і не протидіють активності сполук згідно з даним винаходом при виготовленні відповідних пестицидних сумішей і синергетичних композицій. Фунгіцидні сполуки згідно з даним винаходом можна застосовувати в поєднанні з одним або декількома гербіцидами для знищення широкої

40 різноманітності небажаних рослин. При використанні в поєднанні з гербіцидами сполуки згідно з даним винаходом можна вводити в композицію з гербіцидом (гербіцидами), перемішувати в резервуарі з гербіцидом (гербіцидами) або застосовувати послідовно з гербіцидом (гербіцидами). Типові гербіциди включають, але не обмежуються цим, наступні: 4-хлорфеноксіцтова кислота (4-CPA); 4-хлорфеноксимасляна кислота (4-CPB); 2-(4-хлорфенокси)пропіонова кислота (4-CPD); 2,4-дихлорфеноксіцтова кислота (2,4-D); 3,4-

45 дихлорфеноксіцтова кислота (3,4-DA); 4-(2,4-дихлорфенокси)масляна кислота (2,4-DB); 4-(3,4-дихлорфенокси)масляна кислота (3,4-DB); 2-(2,4-дихлорфенокси)етилбензоат (2,4-DEB); тріс[2-(2,4-дихлорфенокси)етил]фосфіт (2,4-DEP); 2-(3,4-дихлорфенокси)пропіонова кислота (3,4-DP); 2,3,6-трихлорбензойна кислота (2,3,6-TBA); 2,4,5-трихлорфеноксіцтова кислота (2,4,5-T); 2,4,5-трихлорфеноксимасляна кислота (2,4,5-TB); ацетохлор, ацифторфен, аклоніфен,

50 акролеїн, алахлор, алідохлор, алоксидим, аліловий спирт, алорак, аметридін, аметрин, амібозин, амікарбазон, амідосульфурон, аміноциклопірахлор, амінопіралід, аміпрофос-метил, амітрол, сульфамат амонію, анілофос, анізурон, асулам, атратон, атразин, азафенідин, азимсульфурон, азіпротрин, барбан, 1-метилпропіл-N-(3-хлорфеніл)карбамат (BCPC), бефлубутамід, беназолін, бенкарбазон, бенфлуралін, бенфурезат, бенсульфурон, бенсулід,

55 бентазон, бензадокс, бензфендизон, бензипрам, бензобіциклон, бензофенар, бензофтор, бензоїлпроп, бензтіазурон, біциклопірон, біфенокс, біланафос, біспірибак, бура, бромацил, бромобоніл, бромобутид, бромфеноксим, бромоксиніл, бромпіразон, бутахлор, бутафенацил, бутаміфос, бутенахлор, бутидазол, бутіурон, бутралін, бутроксидим, бутурон, бутилат, какоділова кислота, кафенстрол, хлорат кальцію, ціанамід кальцію, камбендихлор, карбасулам,

60 карбетамід, карбоксазол хлорпрокарб, карфентразон, 2-хлор-N,N-діетилацетамід (CDEA), 2-

хлоретил N-(3-хлорфеніл)карбамат (CEPC), хлометоксифен, хлорамбен, хлоранокрил, хлоразифоп, хлоразин, хлорбромурон, хлорбуфам, хлоретурон, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорфлуразол, хлорфлуренол, хлоридазон, хлоримурон, хлорнітрофен, хлоропон, хлоротолурон, хлороксурон, хлороксиніл, хлорпрофам, хлорсульфурон, хлортал, хлортіамід, 5 цинідон-етил, цинметилін, циносульфурон, цизанілід, клетодим, кліодинат, клодинафоп, клофоп, кломазон, кломепроп, клопроп, клопроксидим, клопіралід, клопансулам, ди(гідрометиларсонат)кальцію (CMA), сульфат міді, 1-хлор-N'-(3,4-дихлорфеніл)-N,N-диметилметанімідамід (CPMF), 2-хлор-1-метилетил-N-(3-хлорфеніл)карбамат (CPPC), кредазин, крезол, кумілурун, ціанатрин, ціаназин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, 10 циклурун, цигалофоп, циперкват, ципразин, ципразол, ципромід, даїмурон, далапон, дазомет, делахлор, десмедифам, десметрин, діалат, диамба, дихлобеніл, дихлоральсечовина, дихлормат, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклосулам, діетамкват, діетатил, дифенопентен, дифеноксурон, дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензопір, димефурон, димепіперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамід, диметенамід-Р, димексано, димідазон, 15 динітрамін, динофенат, динопроп, диносам, диносеб, динотерб, дифенамід, дипропетрин, дикват, дисул, дитіопір, діурон, О-(2,4-дихлорфеніл) О-метил (1-метилетил)фосфорамідотіоат (DMPA), 2-метил-4,6-динітрофенол (DNOC), динатрійметиларсонат (DSMA), етил-біс (2-етилгексил)фосфінат (EБЕР), егліназин, ендотал, епроназ, S-етил-N,N-дипропілкарбамотіоат (EPTC), ербон, еспрокарб, еталфлуралін, етаметсульфурон, етидимурон, етіолат, етофумезат, 20 етоксифен, етокисульфурон, етинофен, етніпромід, етобензанід, О,О-діетил-дитіобіс(тіоформіат) (EXD), фенасулам, фенопроп, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксасульфон, фентеракол, фентіапроп, фентразамід, фенурон, сульфат заліза(II), флампроп, флампроп-М, флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазолят, флукарбазон, флуцетосульфурон, флухлоралін, флуфенацет, флуфенікан, 25 флуфенпір, флуметсулам, флумезин, флуміклорак, флуміоксазин, флуміпропун, флуометурон, фтордифен, фторглікофен, фтормідин, фторнітрофен, флуотіурон, флуорксам, флупроацил, флупропанат, флупірсульфурон, флуридон, фторхлоридон, флуороксіпір, флуртамон, флутіацет, фомезафен, форамсульфурон, фосамін, фурилоксифен, глуфосинат, глуфосинат-Р, гліфосат, галосафен, галосульфурон, галоксидин, галоксифоп, галоксифоп-Р, гексахлорацетон, 30 гексафлурад, гексазинон, імазаметабенз, імазамокс, імазапек, імазапек, імазахін, імазетапек, імазосульфурон, інданопан, індазифлам, йодобоніл, йодметан, йодосульфурон, йоксиніл, іпазин, іпфенкарбазон, іпримідам, ізокарбамід, ізоцил, ізометіозин, ізонорипон, ізополінат, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортол, ізоксафлутол, ізоксапіріфоп, карбутилат, кетоспірадокс, лактофен, ленацил, лінурун, метиларсонова кислота (MAA), 35 гідрометиларсонат амонію (MAMA), 2-(4-хлор-2-метилфеноксид)оцтова кислота (MCPA), тіоетил-2-(4-хлор-2-метилфеноксид)ацетат, 4-(4-хлор-2-метилфеноксид)масляна кислота (MCPB), мекопроп, мекопроп-Р, мединотерб, мефенацет, мефлуїдид, мезопразин, мезосульфурон, мезотрион, метилдитіокарбамат, метаміфоп, метамітрон, метазахлор, метазосульфурон, метфлуразон, метабензтіазурон, металпропалін, метазол, метіобенкарб, метіозолін, метіурон, 40 метометон, метопротрин, метилбромід, метилізотіоціанат, метилдимрон, метобензурун, метобромурон, метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метосульфурон, молінат, моналід, монізоурон, монохлороцтова кислота, монолінурун, монурон, морфамкват, гідрометиларсонат натрію (MSMA), напроанілід, напропамід, нафталам, небурон, нікосульфурон, ніпіраклофен, нітралін, нітрофен, нітрофторфен, норфлуразон, норурон, 45 2,3,4,4,5,5,6,6-октахлор-2-циклогексен-1-он (OCH), орбенкарб, орто-дихлорбензол, ортосульфамурон, оризалін, оксациаргіл, оксациазон, оксапіразон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифторфен, парафлурун, паракват, пебулат, пеларгонова кислота, пендиметалін, пеносулам, пентахлорфенол, пентанохлор, пентоксазон, перфлуїдон, петоксамід, фенізофам, фенмедифам, фенмедифам-етил, фенобензурун, ацетат фенілртуті, 50 піклорам, піколінафен, піноксаден, піперофос, арсеніт калію, азид калію, ціанат калію, претілахлор, примісульфурон, проціазин, продіамін, профлуазол, профлуруалін, профоксидим, прогліназин, прометон, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропазин, профам, пропізохлор, пропоксикарбазон, пропірисульфурон, пропізамід, просульфалін, просульфоккарб, просульфурон, проксан, принахлор, піданон, піраклоніл, пірафлуфен, пірасульфотол, 55 піразолінат, піразосульфурон, піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піриклор, піридафол, піридат, пірифталід, піримінобак, піримісульфам, піритіобак, піроксасульфон, піроксулам, хінклорак, хінмерак, хінокламін, хінонамід, хізалофоп, хізалофоп-Р, родетаніл, римсульфурон, сафлуфенацил, S-метолахлор, себутилазин, секбуметон, сетоксидим, сидурон, симазин, симетон, симетрин, хлорацетат натрію (SMA), арсеніт натрію, азид натрію, хлорат натрію, 60 сулькотрион, сульфалат, сульфентразон, сульфометурон, сульфосульфурон, сірчана кислота,

сулглікапін, свеп, 2,2,2-трихлороцтова кислота (ТСА), тебутам, тебутіурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетрафлурон, тенілхлор, тіазафлурон, тіазопір, тидіазимін, тидіазурон, тіенкарбазон-метил, тифенсульфурон, тіобенкарб, тіокарбазил, тіоклорим, топрамезон, 5 тралкоксидим, триафамон, триалат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трикампа, триклопір, тридифан, триетазин, трифлорисульфурон, трифлуралін, трифлусульфурон, трифоп, трифопсим, тригідрокситриазин, триметурон, трипропіндан, тритактритосульфурон, вернолат і ксилахлор.

Ще один варіант здійснення даного винаходу являє собою спосіб боротьби з або запобігання 10 грибковим захворюванням. Даний спосіб включає нанесення фунгіцидно ефективної кількості однієї або декількох сполук формули I на ґрунт, рослину, коріння, листя, насіння або місце грибів, або на місце, в якому потрібно запобігти зараженню (наприклад, нанесення на злакові рослини). Дані сполуки є прийнятними для лікування різноманітних рослин на фунгіцидному рівні і в той же час виявляють низьку фітотосичність. Сполуки можна використовувати для 15 захисту рослин і/або для знищення шкідливих організмів.

Виявлено, що дані сполуки виявляють значний фунгіцидний ефект, зокрема, при використанні в сільському господарстві. Багато сполук є особливо ефективними при використанні для захисту сільськогосподарських рослин і садових рослин. Додаткові переваги можуть включати, але не обмежуються цим, поліпшення здоров'я рослин; підвищення врожайності рослин (наприклад, 20 збільшення біомаси і/або збільшення змісту цінних інгредієнтів); поліпшення сили рослин (наприклад, поліпшення росту рослин і/або збільшення зелені листя); поліпшення якості рослин (наприклад, збільшення вмісту або поліпшення складу певних інгредієнтів); і поліпшення стійкості рослин до абіотичних і/або біотичних стресів.

Фахівцям в даній галузі техніки повинно бути зрозумілим, що ефективність сполук відносно 25 перерахованих вище грибів визначає загальне використання даних сполук як фунгіцидів.

Дані сполуки виявляють активність відносно широкого кола грибкових захворювань. Зразкові захворювання можуть включати, але не обмежуються цим, плямистість листя пшениці (*Septoria tritici*), також відома як *Mycosphaerella graminicola*), парша яблуні (*Venturia inaequalis*), 30 плямистість листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і інших сільськогосподарських рослин, а також чорна сигатока банана (*Mycosphaerella fijiensis*). Точна кількість активного матеріалу, який підлягає застосуванню, залежить не тільки від конкретного використовуваного активного матеріалу, але також від певної бажаної дії, виду грибів, які викликають підлягаюче лікуванню захворювання, і стадії їх росту, а також від частин рослин або інших об'єктів, з якими повинна 35 вступати в контакт дана сполука. Таким чином, всі сполуки і композиції, які містять їх, не можуть бути в рівній мірі ефективними при використанні в однакових концентраціях або проти однакових видів грибів.

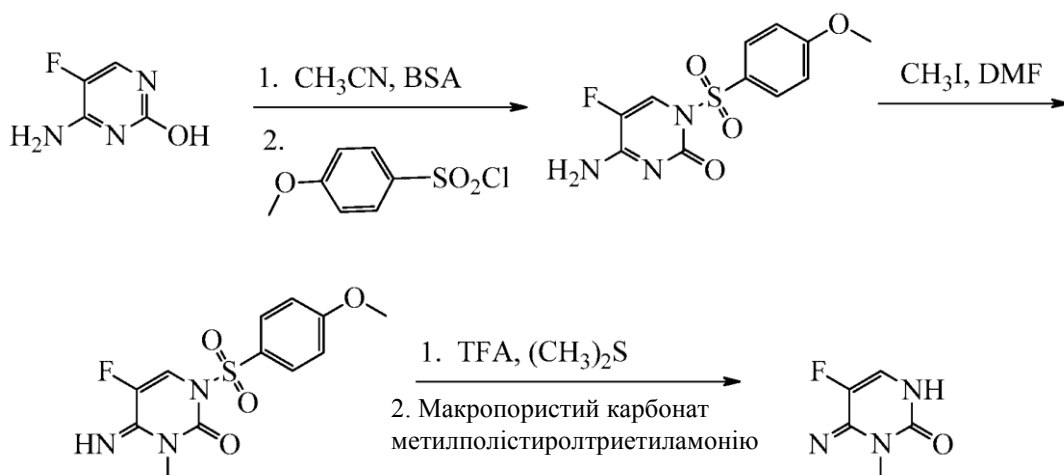
Дані сполуки є ефективними при нанесенні на рослини в фітологічно прийнятній кількості для лікування захворювання. Термін "фітологічно прийнятна кількість для лікування захворювання" 40 означає кількість сполуки, яка знищує або інгібує збудників захворювань рослин, лікування яких є бажаним, але не є істотно токсичною для рослин. Дана кількість становить, як правило, від приблизно 0,1 частини на мільйон до приблизно 1000 частин на мільйон і переважно від 1 частини на мільйон до 500 частин на мільйон. Точна необхідна кількість сполуки змінюється залежно від підлягаючого лікуванню грибового захворювання, типу використовуваної 45 композиції, способу застосування, конкретного виду рослин, кліматичних умов і т. п. Прийнятна для застосування кількість становить, як правило, від приблизно 0,10 до приблизно 4 фунтів на акр (приблизно від 0,01 до 0,45 грамів на квадратний метр, г/м<sup>2</sup>).

Будь-які інтервали або бажані значення, які представлені в цьому документі, можна розширювати або змінювати без втрати необхідних ефектів, що є очевидним для фахівця в 50 даній галузі техніки, який розуміє зміст цього документа.

Сполуки формули I можна виготовляти, використовуючи добре відомі хімічні процедури. Проміжні сполуки, які не згадані певним чином в цьому документі, є в продажу, або їх можна виготовляти способами, описаними в хімічній літературі, або їх можна легко синтезувати з вихідних матеріалів, що є в продажу, використовуючи стандартні процедури.

Наступні приклади представлені, щоб проілюструвати різноманітні аспекти сполук згідно з 55 даним винаходом, і їх не треба тлумачити як обмеження формули винаходу.

Приклад 1. Отримання 5-фтор-4-іміно-3-метил-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-ону (1)



Стадія 1: 4-аміно-5-фтор-1-(4-метоксифенілсульфоніл)піримідин-2(1H)-он. До розчину 4-аміно-5-фтор-піримідин-2-олу\* (1,0 г, 7,75 ммоль) в 50 мл ацетонітрилу ( $\text{CH}_3\text{CN}$ ) додавали біс-N,O-триметилсилілацетамід (BSA; 5,7 мл, 23,3 ммоль), і суміш нагрівали при  $70^\circ\text{C}$  протягом однієї години, отримуючи в результаті прозорий розчин. Після охолодження до кімнатної температури додавали 4-метоксибензол-1-сульфоніл хлорид (1,8 г, 8,5 ммоль) і суміш перемішували протягом 24 годин. Розчинник випаровували, і залишок розділяли між етилацетатом ( $\text{EtOAc}$ ) і сольовим розчином. Органічну фазу сушили над сульфатом магнію ( $\text{MgSO}_4$ ), фільтрували і випаровували розчинник, отримуючи продукт в формі блідо-жовтої твердої речовини (1,48 г, 64%); температура плавлення:  $182-185^\circ\text{C}$ ;  $^1\text{H}$  ЯМР (300 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,40 (шир. с., 1H), 8,11 (д,  $J=5,9$  Гц, 1H), 8,04-7,98 (м, 2H), 7,02-6,96 (м, 2H), 5,77 (шир. с., 1H), 3,88 (с, 3H); ESIMS (мас-спектр з електророзпилювальною іонізацією),  $m/z$ : 300 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

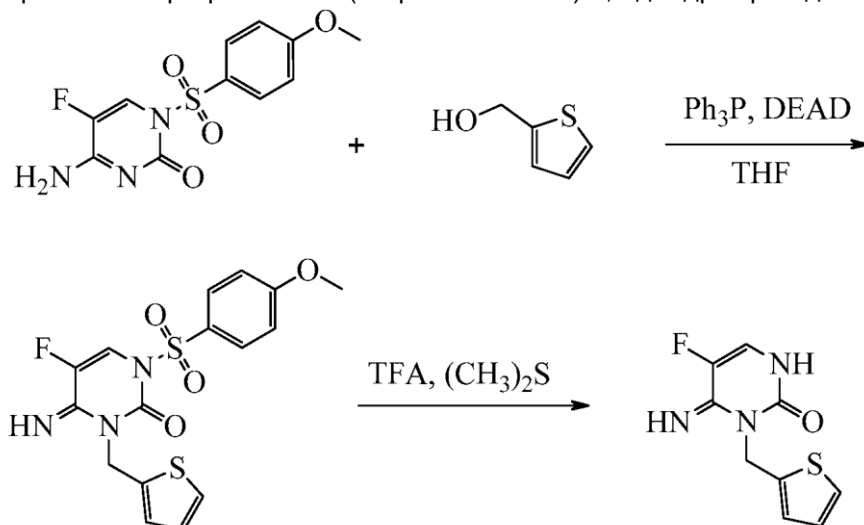
\*Можна використовувати 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол, що є в продажу.

Стадія 2: 5-фтор-4-іміно-1-(4-метоксифенілсульфоніл)-3-метил-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он. У посудину об'ємом 8 мл з гвинтовою кришкою вміщували 4-аміно-5-фтор-1-(4-метоксифенілсульфоніл)-піримідин-2(1H)-он (0,293 г, 0,979 ммоль), безводний карбонат калію ( $\text{K}_2\text{CO}_3$ ; 0,271 г, 1,96 ммоль), і N,N-диметилформамід (DMF; 4 мл), а потім додавали йодметан ( $\text{CH}_3\text{I}$ ; 0,208 г, 1,47 ммоль). Реакційну посудину герметично закривали, і реакційну суміш нагрівали до  $60^\circ\text{C}$  і перемішували протягом 4 годин. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, розбавляли  $\text{EtOAc}$  (20 мл) і промивали водою ( $\text{H}_2\text{O}$ ;  $3 \times 10$  мл). Органічну фазу сушили над сульфатом магнію ( $\text{MgSO}_4$ ), фільтрували і випаровували розчинник при зниженому тиску. В результаті очищення методом флеш-хроматографії на силікагелі ( $\text{SiO}_2$ ) з градієнтом в системі  $\text{EtOAc}$ /гексан отримували цільову сполуку в формі блідо-жовтої твердої речовини (36 мг, 12%); температура плавлення:  $158-162^\circ\text{C}$ ;  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ : 8,01 (д,  $J=9,22$  Гц, 2H), 7,74 (д,  $J=5,27$  Гц, 1H), 7,04 (д,  $J=9,23$  Гц, 2H), 3,90 (с, 3H), 3,31 (с, 3H); ESIMS,  $m/z$ : 314 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

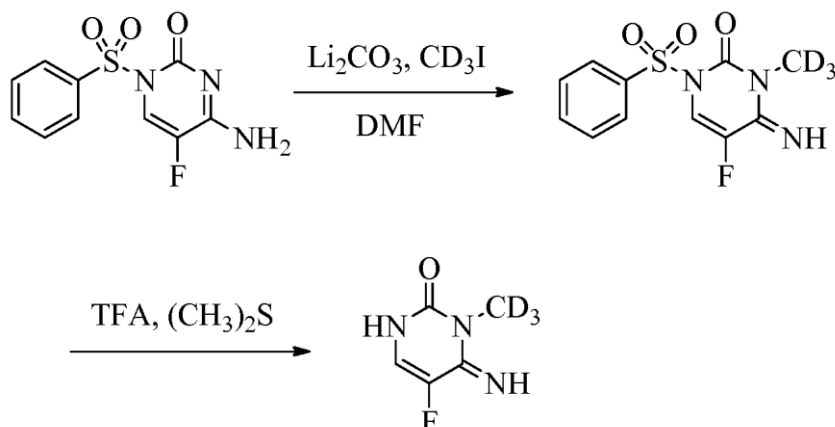
Стадія 3: 5-фтор-4-іміно-3-метил-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он (1). У посудину об'ємом 25 мл з гвинтовою кришкою вміщували 5-фтор-4-іміно-1-(4-метоксифенілсульфоніл)-3-метил-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он (80,4 мг, 0,257 ммоль), трифтороцтову кислоту (TFA; 16,0 мл, 215 ммоль) і диметилсульфід (94,0 мкл, 1,28 ммоль). Отриманий в результаті розчин залишали для перемішування при кімнатній температурі протягом 5,5 годин, а потім концентрували досуха, використовуючи роторний випарник при  $30^\circ\text{C}$ . Неочищений матеріал потім розчиняли в мінімальній кількості метанолу ( $\text{CH}_3\text{OH}$ ;  $\sim 2$  мл) і наносили на 5 г нормальний твердофазний картридж Isco, промиваючи вихідну посудину метанолом ( $3 \times 1$  мл). Твердий картридж потім сушили у вакуумі при кімнатній температурі. Після висушування продукт очищали хроматографічно в колонці з 4 г  $\text{SiO}_2$ , використовуючи градієнт від 0 до 30%  $\text{CH}_3\text{OH}$  в дихлорметані ( $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ ). Отриманий таким способом матеріал, згідно з визначенням, являв собою цільовий продукт, а саме сіль 4-метоксисульфонової кислоти. Вільну основу отримували, розчиняючи матеріал в  $\text{CH}_3\text{OH}$  (4 мл), додаючи смолу (карбонат МП; 345 мг, 3,03 ммоль/г, 4,0 екв.) і залишаючи для перемішування при кімнатній температурі. Після перемішування протягом 20 годин тверду смолу відфільтровували і промивали  $\text{CH}_3\text{OH}$  ( $3 \times 1$  мл). В результаті концентрування у високому вакуумі отримували 5-фтор-4-іміно-3-метил-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он (35,2 мг, 96%) з чистотою 95% в формі білої твердої речовини; температура плавлення:  $181-184^\circ\text{C}$ ;  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ : 7,48 (д,  $J=4,1$  Гц, 1H), 3,22 (с, 3H);  $^{13}\text{C}$

ЯМР (101 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ: 152,19 (с), 151,86 (д, J=27,3 Гц), 136,73 (д, J=221,0 Гц), 129,45 (д, J=26,0 Гц), 28,91 (с).

Приклад 2. Отримання 5-фтор-4-іміно-3-(тіофен-2-ілметил)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-ону (2)



- 5 Стадія 1: 5-фтор-4-іміно-1-((4-метоксифеніл)сульфоніл)-3-(тіофен-2-ілметил)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он. У посудину об'ємом 25 мл на магнітній мішалці вміщували 4-аміно-5-фтор-1-((4-метоксифеніл)сульфоніл)піримідин-2(1H)-он (150 мг, 0,501 ммоль), тіофен-2-ілметанол (172 мг, 1,504 ммоль), трифенілфосфін (Ph<sub>3</sub>P; 394 мг, 1,504 ммоль) і сухий тетрагідрофуран (THF; 4,204 мл). Реакційну суміш вміщували в атмосферу азоту (N<sub>2</sub>) і охолоджували до температури крижаної бані. Після охолодження протягом 10 хвилин краплями додавали діетилазодикарбоксилат (DEAD; 0,238 мл, 1,504 ммоль), і суміш залишали для нагрівання до кімнатної температури протягом ночі. Реакційну суміш випарювали досуха. Неочищений залишок очищали методом хроматографії на SiO<sub>2</sub> з градієнтом в системі EtOAc/гексан, отримуючи цільову сполуку в формі жовто-білого воску (146 мг, 73,8%); <sup>1</sup>H ЯМР (300 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,01 (д, J=9,1 Гц, 2H), 7,84 (д, J=1,8 Гц, 1H), 7,67 (д, J=5,5 Гц, 1H), 7,17 (дд, J=5,2, 1,2 Гц, 1H), 7,13 (д, J=3,5 Гц, 1H), 7,02 (д, J=9,1 Гц, 2H), 6,88 (дд, J=5,1, 3,5 Гц, 1H), 5,28 (с, 2H), 3,91 (с, 3H); ультрафіолетовий спектр (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>), λ<sub>max</sub>: 259 нм; ESIMS, m/z: 396,5 ([M+H]<sup>+</sup>). Стадія 2: 5-фтор-4-іміно-3-(тіофен-2-ілметил)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он (2). При перемішуванні на магнітній мішалці в суміш 5-фтор-4-іміно-1-((4-метоксифеніл)сульфоніл)-3-(тіофен-2-ілметил)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-ону (130 мг, 0,329 ммоль) в сухій TFA (2,529 мл) додавали диметилсульфід (0,122 мл, 1,64 ммоль) в сухій посудині об'ємом 25 мл в атмосфері аргону. Реакційну суміш перемішували при 23°C протягом 16 годин. Реакційну суміш випарювали досуха, і неочищений залишок розбавляли водою з льодом і водним насиченим розчином бікарбонату натрію, а потім двічі екстрагували CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>. Шари розділяли, об'єднані органічні екстракти випарювали, і неочищений залишок очищали методом хроматографії на SiO<sub>2</sub> з градієнтом в системі EtOAc/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, отримуючи цільову сполуку в формі білуватого воску (15 мг, 19,2%); <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub> + D<sub>2</sub>O) δ: 7,22 (шир. д, J=3,4 Гц, 1H), 7,21 (дд, J=5,2, 1,1 Гц, 1H), 6,94 (дд, J=5,1, 3,5 Гц, 1H), 6,72 (д, J=4,3 Гц, 1H), 5,38 (с, 2H); <sup>13</sup>C ЯМР (101 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ: 152,48 (д, J=30,5 Гц), 151,06 (с), 138,17 (с), 137,82 (с), 128,48 (с), 126,30 (с), 125,76 (с), 115,39 (д, J=35,1 Гц), 39,30 (с); ESIMS, m/z: 226,3 ([M+H]<sup>+</sup>), 224,4 ([M-H]<sup>+</sup>). Приклад 3. Отримання 5-фтор-4-іміно-3-(тридеїтеріометил)-1H-піримідин-2-ону (3)



Стадія 1: 1-(бензолсульфоніл)-5-фтор-4-іміно-3-(тридейтеріометил)піримідин-2-он. Розчин 4-аміно-5-фтор-1-(фенілсульфоніл)піримідин-2(1H)-ону (600 мг, 2,23 ммоль), виготовлений як описали Т. Воебел і інш. в міжнародній патентній заявці WO 2011/017547 А, в диметилформаміді (DMF; 7 мл) обробляли карбонатом літію (333 мг, 4,51 ммоль) і йодометаном- $\text{d}_3$  (807 мг, 5,56 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при  $45^\circ\text{C}$  протягом 3,5 годин. Додавали етилацетат (EtOAc; 10 мл) і насичений водний розчин хлориду натрію (10 мл), і шари розділяли. Водний шар екстрагували ще два рази EtOAc ( $2 \times 5$  мл). Об'єднані органічні шари промивали насиченим водним розчином хлориду натрію ( $3 \times 5$  мл), сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  і концентрували при зниженому тиску. Отриману в результаті тверду речовину очищали методом хроматографії на силікагелі, використовуючи градієнт від 0 до 80% EtOAc в гексані, і отримували цільову сполуку в формі білої твердої речовини (307 мг, 48%):  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,11 (м, 2H); 7,85-7,61 (шир. м, 4H);  $^{19}\text{F}$  ЯМР (375 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 158,14;  $^{13}\text{C}$  ЯМР (101 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 152,18, 151,91, 151,64, 142,35, 137,76, 135,56, 129,79, 129,55; ESIMS,  $m/z$ : 287,1 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

Стадія 2: 5-фтор-4-іміно-3-(тридейтеріометил)-1H-піримідин-2-он (3). Розчин 1-(бензолсульфоніл)-5-фтор-4-іміно-3-(тридейтеріометил)піримідин-2-ону (360 мг, 1,26 ммоль) розчиняли в суміші 2,2,2-трифтороцтової кислоти (31,9 ммоль, 2,4 мл) і диметилсульфіду (5,9 ммоль, 0,57 мл) протягом 2 годин при кімнатній температурі і концентрували при зниженому тиску. Отриманий в результаті аморфний гель очищали при зниженому тиску і потім очищали методом хроматографії на силікагелі, використовуючи при елююванні градієнт від 0 до 50% MeOH в дихлорметані. Після випарювання досуха очищеного продукту його розчиняли в безводному метанолі (10 мл) і повільно перемішували протягом двох діб з 1,5 г гранул, що містять полістирол і карбонат кальцію. Потім продукт відділяли фільтруванням у вакуумі і випаровуванням до постійної маси, отримуючи цільову сполуку в формі білої твердої речовини (59 мг, 40%):  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{DMSO}-\text{d}_6$ )  $\delta$ : 7,5 (с, 1H);  $^{19}\text{F}$  ЯМР (375 МГц,  $\text{DMSO}-\text{d}_6$ )  $\delta$ : 171,45;  $^{13}\text{C}$  ЯМР (101 МГц,  $\text{DMSO}-\text{d}_6$ )  $\delta$ : 152,18, 151,64, 137,76, 135,56, 129,66; ESIMS,  $m/z$ : 147,2 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

Приклад 4. Оцінка фунгіцидної активності: плямистість листя пшениці (*Mycosphaerella graminicola*; анаморф: *Septoria tritici*; код Bayer: SEPTTR)

Рослини пшениці (різновид Yuma) вирощували з насіння в оранжереї, використовуючи 50% мінерального ґрунту і 50% безґрунтової суміші Metro, доти, поки перший листок не з'являвся повністю, саджаючи по 7-10 проростків в кожний горщик. Ці рослини засівали водною суспензією спор грибів *Septoria tritici* до або після обробки фунгіцидом. Після посіву рослини витримували в умовах 100% відносної вологості (протягом доби в темній зрошуваній камері і потім протягом двох або трьох діб в освітленій зрошуваній камері), щоб надати спорам можливість розвитку і інфікування листя. Рослини потім переносили в оранжерею для розвитку захворювання.

Приклад 5. Оцінка фунгіцидної активності: парша яблуні (*Venturia inaequalis*; код Bayer: VENTIN) Яблуневі саджанці сортів McIntosh або Golden Delicious вирощували в суміші Metro і засівали суспензією спор, що містить  $5 \times 10^5$  спор/мл. Рослини витримували в зрошуваній камері протягом 24 годин в умовах 100% відносної вологості і потім переносили в оранжерею з температурою  $18^\circ\text{C}$  для розвитку захворювання.

Наступна таблиця представляє активність типових сполук згідно з даним винаходом, які оцінювали в даних експериментах. Ефективність досліджуваних сполук в лікуванні захворювань визначали шляхом оцінки ступеня захворювання у рослин, що виліковуються, і потім перераховували ступінь захворювання в процентну частку успіху лікування шляхом порівняння зі ступенем захворювання у заражених, але не отримуючих лікування рослин.

У кожному випадку таблиця I представляє рівні оцінки таким чином:

Процентна частка успіху в лікуванні захворювання	Оцінка
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
Не досліджено	E

Таблиця I

Активність сполук в однодобовому захисті (1DP) і тридобовому лікуванні (3DC) відносно до SEPTTR при вмісті 100 частин на мільйон

Сполука	Однодобовий захист SEPTTR (100 частин на мільйон)	Тридобове лікування SEPTTR (100 частин на мільйон)
1	A	A
2	B	A
3	D	D

5

Таблиця II

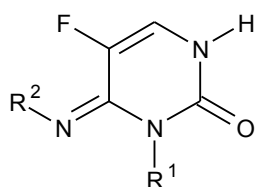
Активність сполук в однодобовому захисті (1DP) відносно VENTIN при вмісті 100 частин на мільйон

Сполука	Однодобовий захист VENTIN (100 частин на мільйон)
1	B

### ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули I:

10



, Формула I

в якій R<sup>1</sup> являє собою метил, тіофен-2-ілметил або тридейтеріометил; і R<sup>2</sup> являє собою H.

15 2. Композиція для боротьби з грибовими захворюваннями, яка містить сполуку за п. 1 і фітологічно прийнятний матеріал носія.

3. Композиція за п. 2 для боротьби з грибовими захворюваннями, що являють собою щонайменше одне з наступних: парша яблуні (*Venturia inaequalis*), плямистість листя пшениці (*Septoria tritici*), плямистість листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personation*) і чорна сигаточка банана (*Mycosphaerella fijiensis*).

20 4. Спосіб боротьби з грибовими захворюваннями рослин і запобігання грибовим захворюванням рослин, що включає стадії нанесення фунгіцидно ефективної кількості щонайменше однієї зі сполук за п. 1 щонайменше на один з наступних об'єктів: рослина, ділянка  
25 навколо рослини, ґрунт, призначений для забезпечення росту рослини, корінь рослини, листя рослини і насіння, призначене для вирощування рослини.



5. Пестицидний склад, який містить сполуку за п. 1 і другу пестицидну сполуку, вибрану з групи, що складається з фунгіцидів, інсектицидів, гербіцидів, нематоцидів, акарицидів, артроподицидів, бактерицидів або їх поєднань.

6. Пестицидний склад за п. 5, в якому масове співвідношення сполуки за п. 1 і другої пестицидної сполуки складає від 1:100 до 100:1.

7. Пестицидний склад за п. 5, в якому друга пестицидна сполука є фунгіцидною сполукою, вибраною з групи, що включає: 2-(тіоціанатометилтіо)бензотіазол, 2-фенілфенол, 8-гідроксихінолінсульфат, аметоктрадин, амисульбром, антимицин, виробляючий ампеломіцин гриб *Ampelomyces quisqualis*, азокназол, азоксистробін, сінну паличку (*Bacillus subtilis*), беналаксил, беномил, бентіавалікарбізопропіл, сіль бензиламінобензолсульфонату (BABS), бікарбонати, біфеніл, бісмертіазол, бітертанол, біксафен, бластицидин-S, буру, бордоську суміш, боскалід, бромукназол, бупіримат, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карпропамід, карвон, хлоронеб, хлороталоніл, клозолінат, гриб *Coniothyrium minitans*, гідроксид міді, октаноат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, (триосновний) сульфат міді, оксид міді(I), ціазофамід, цифлуфенамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дазомет, дебакарб, етиленбіс(дитіокарбамат) діамонію, дихлофлуанід, дихлорофен, диклоцимет, дикломезин, дихлоран, діетофенкарб, дифенокназол, іон-дифензокват, дифлуметорим, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М, динобутон, динокап, дифеніламін, дитіанон, додеморф, додеморфацетат, додин, вільну основу додину, едифенфос, енестробін, епоксикназол, етабоксам, етоксикін, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенексамід, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фенпіразамін, фентин, фентинацетат, фентингідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуморф, флуопіколід, флуопірам, флуороїмід, флуоксастробін, флукінконазол, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, флуксапіроксад, фолпет, формальдегід, фозетил, фосетилалюміній, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, гуазатин, гуазатинацетати, тетратіопероксокарбонат натрію (GY-81), гексахлорбензол, гексакназол, гімексазол, імазаліл, імазалілсульфат, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадинтриацетат, іміноктадинтрис(альбезилат), йодокарб, іпконазол, іпфенпіразолон, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротіолан, ізопіразам, ізотіаніл, ламінарин, касугаміцин, гідрат касугаміцингідрохлориду, крезоксим-метил, манкопер, манкоцеб, мандипропамід, манеб, мефеноксам, мепаніпірим, мепроніл, мептил-динокап, хлорид ртуті(II), оксид ртуті(II), хлорид ртуті(I), металаксил, металаксил-М, метилдитіокарбамат, метилдитіокарбамат амонію, метилдитіокарбамат калію, метилдитіокарбамат натрію, метконазол, метасульфоккарб, метилйодид, метилізотіоціанат, метирам, метоміностробін, метрафенон, мілдіоміцин, мікробутаніл, набам, нітроталізопропіл, нуаримол, октилінон, офурас, олеїнову кислоту (жирна кислота), оризастробін, оксаксидил, оксин міді, окспоконазолфумарат, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенол, пентахлорфеніллаурат, пентіопірат, ацетат фенілртуті, фосфонову кислоту, фталід, пікоксистробін, поліоксин В, поліоксини, поліоксорим, бікарбонат калію, гідроксихінолінсульфат калію, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамоккарб, пропамоккарбгідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, прохіназид, протіокназол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос, пірибенкарб, пірибутикарб, пірифенокс, піриметаніл, піріофенон, пірохілон, хінокламін, хіноксифен, хінтозен, екстракт гірчака сахалінського (*Reynoutria sachalinensis*), седаксан, силтіофам, симекназол, 2-фенілфеноксид натрію, бікарбонат натрію, пентахлорфеноксид натрію, спіроксамін, сірку, енестроурин (SYP-Z071), 5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметил-3-(піридин-3-іл)-оксазолін (SYP-Z048), дігтярні масла, тебуконазол, тебуфлуксин, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, трифорин, тритиконазол, валідаміцин, валіфеналат, валіфенал, вінклозолін, цинеб, цирам, цоксамід, гриб *Candida oleophila*, гриб *Fusarium oxysporum*, гриби видів роду *Gliocladium*, гриб *Phlebiopsis gigantea*, гриб *Streptomyces griseoviridis*, гриби видів роду *Trichoderma*, (RS)-N-(3,5-дихлорфеніл)-2-(метоксиметил)сукцинімід, 1,2-дихлорпропан, 1,3-дихлор-1,1,3,3-тетрафторацетонгідрат, 1-хлор-2,4-динітронафталін, 1-хлор-2-нітропропан, 2-(2-гептадецил-2-імідазолін-1-іл)етанол, 2,3-дигідро-5-феніл-1,4-дитіін-1,1,4,4-тетраоксид, ацетат 2-метоксіетилртуті, хлорид 2-метоксіетилртуті, силікат 2-метоксіетилртуті, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 4-(2-нітропроп-1-еніл)фенілтіоціанат, ампропілфос, анілазин, азитирам, полісульфід барію, трис(1-додецил-3-метил-2-фенілбензімідазолію) гексаціаноферат (Bayer 32394), беноданіл, бенхінокс, бенталурон, бензамакріл, бензамакріл-ізобутил, бензаморф, бінапакрил, біс(метилртуті) сульфат, біс(трибутилолова) оксид, бутіобат, хромат-сульфат кадмію-кальцію-міді-цинку,

- карбаморф, ундециленамідпропілбетаїн (CECA), хлорбентіазон, хлораніформетан, хлорфеназол, хлорхінокс, клімбазол, циклафурамід, ципендазол, ципрофурам, декафентин, дихлон, дихлозолін, диклобутразол, диметиримол, диноктон, диносальфон, динотербон, дипіритіон, диталіфос, додизин, дразоксолон, S-бензил-О, О-діетилфосфоротіолят (EBP), О-етил-S-бензилфенілфосфонотіоат (ESBP), етаконазол, етем, етирим, фенаміносальф, фенапаніл, фенітропан, флуотримазол, фуркарбаніл, фурконазол, цис-фурконазол, фурмециклокс, фуорофанат, гліюдин, гризеофульвін, галакринат, 5-хлор-4-феніл-1,2-дитіол-3-он (Hercules 3944), гексилтіофос, N-(6-метокси-3-піридиніл)циклопропанкарбоксамід (ICIA 0858), ізопамфос, ізоваледіон, мебеніл, мекарбінзид, метазоксолон, метфуроксам, диціандіамід метилртуті, метсульфовакс, мілнеб, мукохлорний ангідрид, міклозолін, N-3,5-дихлорфенілсукцинімід, N-3-нітрофенілітаконімід, натаміцин, N-етилмеркуріо-4-толуолсульфонанілід, біс(диметилдитіокарбамат) нікелю, 2,3,4,4,5,5,6,6-октахлор-2-циклогексен-1-он (OCH), диметилдитіокарбамат фенілртуті, нітрат фенілртуті, фосдифен, піколінамід UK-2A і його похідні, протіокарб, протіокарбгідрохлорид, піракарболід, піридинітрил, піроксифлор, піроксифур, хінацетол, хінацетолсульфат, хіназамід, хінконазол, рабензазол, саліциланілід, 1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)циклопентан-1-ол (SSF-109), сультропен, текорам, тіадифтор, тиціофен, тіохлорфенфін, тіофанат, тіохінокс, тіоксимід, триаміфос, триаримол, триазбутил, трихлорамід, урбацил, зариламід і будь-які їх поєднання.
8. Пестицидний склад за п. 5, в якому друга пестицидна сполука є пестицидною сполукою, вибраною з групи, що включає: 1,2-дихлорпропан, абамектин, ацефат, ацетаміпрід, ацетир, ацетопрол, акринатрин, акрилонітрил, аланікарб, алдікарб, альдоксикарб, алдрин, алетрин, алозамідин, аліксикарб, альфа-циперметрин, альфа-екдизон, альфа-ендосальфан, амідітін, амінокарб, амітон, амітоноксалат, амітраз, анабазин, атідатіон, азадирахтин, азаметифос, азинфос-етил, азинфос-метил, азотоат, гексафторсилікат барію, батрин, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бета-суфлутрин, бета-циперметрин, біфентрин, біоалетрин, біоетанометрин, біоперметрин, бістрифлурон, буру, борну кислоту, бромфенвінфос, бромциклєн, бромдихлордифенілтрихлоретан (DDT), бромфос, бромфос-етил, буфенкарб, бупрофезин, бутаккарб, бутатіофос, бутоксикарбоксим, бутонат, бутоксикарбоксим, кадузафос, арсенат кальцію, полісульфід кальцію, камфехлор, карбанолят, карбарил, карбофуран, сірковуглець, тетрахлорид вуглецю, карбофенотіон, карбосальфан, картап, картапгідрохлорид, хлорантраніліпрол, хлорбіциклєн, хлордан, хлордекон, хлордимеформ, хлордимеформгідрохлорид, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлороформ, хлорпікрин, хлорфоксим, хлорпразофос, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлортіофос, хромафенозид, цинерин I, цинерин II, цинерини, цисметрин, клоетокарб, клозантел, клотіанідин, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, нафтенат міді, олеат міді, кумафос, сумітоат, кротамітон, кротоксифос, круфомат, кріоліт, ціанофенфос, ціанофос, ціантоат, ціантраніліпрол, циклетрин, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, циперметрин, цифенотрин, циромазин, цитіоат, дихлордифенілтрихлоретан (DDT), декарбофуран, дельтаметрин, демефін, демефін-О, демефін-S, деметон, деметон-метил, деметон-О, деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діафентіурон, діаліфос, діатомову землю, діазинон, дикаптон, дихлофентіон, дихлорвос, дикрезил, дикротофос, дицикланіл, дильдрин, дифлубензулон, дилор, димефлутрин, димефокс, диметан, диметоат, диметрин, диметилвінфос, диметилан, динекс, динекс-диклексин, динопроп, динозам, динотефуран, діофенолан, діоксабензофос, діоксикарб, діоксатіон, дисульфотон, дитіокрофос, d-лімонен, динітро-о-крезол (DNOC), динітро-о-крезолят амонію, динітро-о-крезолят калію, динітро-о-крезолят натрію, дорамектин, екдистерон, емаектин, емаектинбензоат, 4-етилтіофенілметилкарбамат (EMPC), емпентрин, ендосальфан, ендотіон, ендрин, О-етил-О-(4-нітрофеніл)фенілфосфонотіоат (EPN), епофенонан, еприномектин, есдепалетрин, есфенвалерат, етафос, етіофенкарб, етіон, етіпрол, етоат-метил, етопрофос, етилформіат, етил-1-хлор-4-[2,2-дихлор-1-(4-хлорфеніл)етил]бензол (DDD), етилендібромід, етилендихлорид, етиленоксид, етофенпрокс, етримфос, етилксантогендисульфід (EXD), фамфур, фенаміфос, феназафлор, фенхлорфос, фенетакарб, фенфлутрин, фенітротіон, фенобукарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпіритрин, фенпропатрин, фенсульфотіон, фентіон, фентіон-етил, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флукофулон, флуциклоксурон, флусутринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфенпрокс, флуфіпрол, флувалінат, фонофос, форметанат, форметанатгідрохлорид, формотіон, формпаранат, формпаранатгідрохлорид, фосметилан, фоспірат, фостіетан, фураціокарб, фуретрин, гамма-цигалотрин, гамма-гексахлорциклогексан (HCH), галфенпрокс, галофенозид, гексахлорциклогексан (HCH), 1,2,3,4,10,10-гексахлор-6,7-епоксі-1,4,4a,5,6,7,8,8a-октагідро-1,4,5,8-диметанонафталін (HEOD), гептахлор, гептенофос, гетерофос, гексафлумурон,

гексахлоро-1,4,4а,5,8,8а-гексагідро-1,4-ендо, екзо-5,8-диметанонафталін (HHDN), гідраметилнон, ціанистий водень, гідропрен, гіксинкарб, імідаклоприд, іміпротрин, індоксакарб, йодметан, S-[(етансульфініл)метил]-О,О-ди(пропан-2-іл)фосфордитіоат (IPSP), ізазофос, ізобензан, ізокарбофос, ізодрин, ізофенфос, ізофенфос-метил, ізопрокарб, ізопротіолан, ізотіоат, ізоксатіон, івермектин, джасмолін I, джасмолін II, джодфенфос, ювенільний гормон I, ювенільний гормон II, ювенільний гормон III, келеван, кінопрен, лямбда-цигалотрин, арсенат свинцю, лепіметин, лептофос, ліндан, ліримфос, люфенурон, літидатіон, малатіон, малонобен, мазидох, мекарбам, мекарфон, маназон, меперфлутрин, мефосфолан, хлорид ртуті(І), месульфенфос, метафлумізон, метакрифос, метамідофос, метидатіон, метіокарб, метокротофос, метоміл, метопрен, метоксихлор, метоксифенозид, метилбромід, метилізотіоціанат, метилхлороформ, метиленхлорид, метофлутрин, метолкарб, метоксadiaзон, мевінфос, мексакарбат, мілбемектин, мілбеміциноксим, міпафокс, мірекс, молосультап, монокротофос, мономегіпо, моносультат, морфотіон, моксидектин, нафталофос, налед, нафталін, нікотин, ніфлуридид, нітенпірам, нітіазин, нітрилакарб, новалурон, новіфлумурон, ометоат, оксаміл, оксидеметон-метил, оксидефосфос, оксидисульфотон, пара-дихлорбензол, паратіон, паратіон-метил, пенфлурон, пентахлорфенол, перметрин, фенкаптон, фенотрин, фентоат, форат, фосалон, фосфолан, фосмет, фосніхлор, фосфамідон, фосфін, фоксим, фоксим-метил, піриметафос, піримікарб, піриміфос-етил, піриміфос-метил, арсенат калію, тіоціанат калію, 1,1,1-трихлор-2,2-ди(п-хлорфеніл) (п,п'-DDT), пралетрин, прекоцен I, прекоцен II, прекоцен III, примідофос, профенофос, профлуралін, промацил, промекарб, пропафос, пропетамфос, пропоксур, протидатіон, протіофос, протоат, протрифенбут, піраклофос, пірафлупрол, піразофос, піресметрин, піретрин I, піретрин II, піретрини, піридабен, піридаліл, піридафентіон, пірифлухіназон, піримідифен, піримітат, пірипрол, пірипроксифен, квасію, хіналфос, хіналфос-метил, хінотіон, рафоксанід, ресметрин, ротенон, ріанію, сабадилу, шрадан, селамектин, силафлуофен, силікагель, арсеніт натрію, фторид натрію, гексафторсилікат натрію, тіоціанат натрію, софамід, спінеторам, спіносад, спіромезифен, спіротетрамат, сулькофурон, сулькофурон натрію, сульфлурамід, сульфотеп, сульфоксафлор, фтористий сульфурил, сульпрофос, тау-флувалінат, тазимкарб, тетрахлордифенілетан (TDE), тебуфенозид, тебуфенпірад, тебупіримфос, тефлурбензурон, тефлутрин, темефос, тетраетилдифосфат (TEPP), тералетрин, тербуфос, тетрахлоретан, тетрахлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тета-циперметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тикрофос, тіокарбоксим, тіоциклам, тіоцикламоксалат, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіосультап, динатрійтіосультап, мононатрійтіосультап, турингієнсин, толфенпірад, тралометрин, трансфлутрин, трансперметрин, триаратен, триазамат, триазофос, трихлорфон, трихлорметафос-3, трихлоронат, трифенофос, трифлумурон, триметакарб, трипрен, вамідотіон, ваніліпрол, 3,5-диметилфенілметилкарбамат (ХМС), ксилілкарб, зета-циперметрин, золапрофос і будь-які їх поєднання.

9. Пестицидний склад за п. 5, в якому другою пестицидною сполукою є гербіцидна сполука, вибрана з групи, яка включає: 4-хлорфеноксіоцтову кислоту (4-CPA); 4-хлорфеноксімаєляну кислоту (4-CPB); 2-(4-хлорфенокси)пропіонову кислоту (4-CPD); 2,4-дихлорфеноксіоцтову кислоту (2,4-D); 3,4-дихлорфеноксіоцтову кислоту (3,4-DA); 4-(2,4-дихлорфенокси)маєляну кислоту (2,4-DB); 4-(3,4-дихлорфенокси)маєляну кислоту (3,4-DB); 2-(2,4-дихлорфенокси)етилбензоат (2,4-DEB); трис[2-(2,4-дихлорфенокси)етил]фосфіт (2,4-DEP); 2-(3,4-дихлорфенокси)пропіонову кислоту (3,4-DP); 2,3,6-трихлорбензойну кислоту (2,3,6-TBA); 2,4,5-трихлорфеноксіоцтову кислоту (2,4,5-T); 2,4,5-трихлорфеноксімаєляну кислоту (2,4,5-TB); ацетохлор, ацифторфен, аклоніфен, акролеїн, алахлор, алідохлор, алоксидим, аліловий спирт, алорак, аметридіон, аметрин, амібозин, амікарбазон, амідосульфурон, аміноциклопірахлор, амінопіралід, аміпрофос-метил, амітрол, сульфамат амонію, анілофос, анізурон, асулам, атратон, атразин, азафенідин, азимсульфурон, азіпротрин, барбан, 1-метилпропіл-N-(3-хлорфеніл)карбамат (BCPC), бефлубутамід, беназолін, бенкарбазон, бенфлуралін, бенфурезат, бенсульфурон, бенсулід, бентазон, бензадокс, бензфендизон, бензипрам, бензобіциклон, бензофенар, бензофтор, бензоїлпроп, бензтіазурон, біциклопірон, біфенокс, біланафос, біспірибак, буру, бромацил, бромобоніл, бромобутид, бромфеноксим, бромоксиніл, бромпіразон, бутахлор, бутафенацил, бутаміфос, бутенахлор, бутидазол, бутіурон, бутралін, бутроксидим, бутурон, бутилат, какоділову кислоту, кафенстрол, хлорат кальцію, ціанамід кальцію, камбендихлор, карбасулам, карбетамід, карбоксазол хлорпрокарб, карфентразон, 2-хлор-N,N-діетилацетамід (CDEA), 2-хлоретил N-(3-хлорфеніл)карбамату (CEPC), хлометоксифен, хлорамбен, хлоранокрил, хлоразифоп, хлоразин, хлорбромурон, хлорбуфам, хлоретурон, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорфлуразол, хлорфлуренол, хлоридазон, хлоримурон, хлорнітрофен, хлоропон, хлоротолурон, хлороксурон, хлороксиніл, хлорпрофам,

хлорсульфурон, хлортал, хлортиамід, цинідон-етил, цинметилін, циносульфурон, цизанілід, клетодим, кліодинат, клодинафоп, клофоп, кломазон, кломепроп, клопроп, клопроксидим, клопіралід, клопансулам, ди(гідрометиларсонат) кальцію (СМА), сульфат міді, 1-хлор-N'-(3,4-дихлорфеніл)-N,N-диметилметанімідамід (СРМФ), 2-хлор-1-метилетил-N-(3-хлорфеніл)карбамат (СРРС), кредазин, крезол, кумілурун, ціанатрин, ціаназин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, циклурун, цигалофоп, циперкват, ципразин, ципразол, ципромід, даїмурун, далапон, дазомет, делахлор, десмедифам, десметрин, діалат, диамбу, дихлобеніл, дихлоральсечовину, дихлормат, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклосулам, діетамкват, діетатил, дифенопентен, дифеноксурон, дифензокват, дифлуфенікан, 10 дифлуфензопір, димефурон, димепіперат, диметаклор, диметаметрин, диметенамід, диметенамід-Р, димексано, димідазон, динітрамін, динофенат, динопроп, диносам, диносеб, динотерб, дифенамід, дипропетрин, дикват, дисул, дитіопір, діурун, О-(2,4-дихлорфеніл) О-метил-(1-метилетил)фосфорамідотіоату (DMPA), 2-метил-4,6-динітрофенол (DNOC), динатрійметиларсонат (DSMA), етилбіс(2-етилгексил)фосфінат (ЕВЕР), егліназин, ендотал, епроназ, S-етил-N,N-дипропілкарбамотіоат (EPTC), ербон, еспрокарб, еталфлуралін, 15 етаметсульфурон, етидимурон, етіолат, етофумезат, етоксифен, етоксисульфурон, етинофен, етніпромід, етобензанід, О,О-діетилдитіобіс(тіоформіат) (EXD), фенасулам, фенопроп, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксасульфон, фентеракол, фентіапроп, фентразамід, фенурун, сульфат заліза(II), флампроп, флампроп-М, флазасульфурон, флорасулам, 20 флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазолят, флукарбазон, флуцетосульфурон, флухлоралін, флуфенацет, флуфенікан, флуфенпір, флуметсулам, флумезин, флуміклорак, флуміоксазин, флуміпропун, флуометурон, фтордифен, фторглікофен, фтормідин, фторнітрофен, флуотіурун, флуороксам, флупропацил, флупропанат, флупірсульфурон, флуридон, фторхлоридон, флуороксіпір, флуртамон, флутіацет, фомезафен, форамсульфурон, фосамін, фурилоксифен, 25 глуфосинат, глуфосинат-Р, гліфосат, галосафен, галосульфурон, галооксидин, галооксифоп, галооксифоп-Р, гексахлорацетон, гексафлурат, гексазинон, імазаметабенз, імазамокс, імазапек, імазапек, імазахін, імазетапек, імазосульфурон, інданофан, індазифлам, йодобоніл, йодметан, йодосульфурон, іоксиніл, іпазин, іпфенкарбазон, іпримідам, ізокарбамід, ізоцил, ізометіозин, ізонорипон, ізополінат, ізопропалін, ізопротурон, ізоурун, ізоксабен, ізоксахлортол, 30 ізоксафлутол, ізоксапірифоп, карбутилат, кетоспірадокс, лактофен, ленацил, лінурун, метиларсонову кислоту (ММА), гідрометиларсонат амонію (МАМА), 2-(4-хлор-2-метилфеноксі)оцтову кислоту (МCPA), тіоетил-2-(4-хлор-2-метилфеноксі)ацетат, 4-(4-хлор-2-метилфеноксі)масляну кислоту (MCPB), мекопроп, мекопроп-Р, мединотерб, мефенацет, мефлуїдид, мезопразин, мезосульфурон, мезотріон, метилдитіокарбамат, метаміфоп, 35 метамітрон, метазахлор, метазосульфурон, метфлуразон, метабензтіазурун, металпропалін, метазол, метіобенкарб, метіозолін, метіурун, метометон, метопротрин, метилбромід, метилізотіоціанат, метилдимурон, метобензурун, метобромурон, метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, молінат, моналід, монізоурун, монохлороцтову кислоту, монолінурун, монурон, морфамкват, гідрометиларсонат натрію (MSMA), напроанлід, 40 напропамід, нафталам, небурун, нікосульфурон, ніпіраклофен, нітралін, нітрофен, нітрофторфен, норфлуразон, норурун, 2,3,4,4,5,5,6-октахлор-2-циклогексен-1-он (ОСН), орбенкарб, ортодихлорбензол, ортосульфамурон, оризалін, оксадіаргіл, оксадіазон, оксапіразон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифторфен, парафлурун, паракват, пебулат, пеларгонову кислоту, пендиметалін, пеноксиулам, пентахлорфенол, пентанохлор, пентоксазон, 45 перфлуїдон, петоксамід, фенізофам, фенмедифам, фенмедифам-етил, фенобензурун, ацетат фенілртуті, піклорам, піколінафен, піноксаден, піперофос, арсеніт калію, азид калію, ціанат калію, претилахлор, примісульфурон, проціазин, продіамін, профлуазол, профлуралін, профоксидим, прогліназин, прометон, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропазин, профам, пропізохлор, пропоксикарбазон, пропірсульфурон, пропізамід, 50 просульфалін, просульфоккарб, просульфурон, проксан, принахлор, піданон, піраклоніл, пірафлуфен, пірасульфотол, піразолінат, піразосульфурон, піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піриклор, піридафол, піридат, пірифталід, піримінобак, піримісульфан, піритіобак, піроксасульфурон, піроксулам, хінклорак, хінмерак, хінокламін, хінонамід, хізалофоп, хізалофоп-Р, родетаніл, римсульфурон, сафлуфенацил, S-метолахлор, себутилазин, секбуметон, 55 сетоксидим, сидурун, симазин, симетон, симетрин, хлорацетат натрію (SMA), арсеніт натрію, азид натрію, хлорат натрію, сулькотріон, сульфалат, сульфентразон, сульфометурон, сульфосульфурон, сірчану кислоту, сулглікапін, свеп, 2,2,2-трихлороцтову кислоту (ТСА), тебутам, тебутіурун, тефурилтріон, темботріон, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетрафлурун, тенілхлор, тіазафлурун, 60 тіазопір, тидіазимін, тидіазурун, тіенкарбазон-метил, тифенсульфурон, тіобенкарб, тіокарбазил,

тіоклорим, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, триалат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трикампу, триклопір, тридифан, триетазин, трифлорисульфурон, трифлуралін, трифлусульфурон, трифоп, трифопсим, тригідрокситриазин, триметурон, трипропіндан, тритактритосульфурон, вернолат і ксилахлор.

- 5 10. Композиція за п. 2, в якій концентрація сполуки складає від 0,1 до 1000 ч/млн.
11. Композиція за п. 2, в якій концентрація сполуки складає від 1 до 500 ч/млн.
12. Спосіб за п. 4, в якому фунгіцидно ефективна кількість складає від 0,01 до 0,45 грам/м<sup>2</sup>.
13. Сполука за п. 1, де сполука формули I являє собою 5-фтор-4-іміно-3-метил-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он.
- 10 14. Сполука за п. 1, де сполука формули I являє собою 5-фтор-4-іміно-3-(тіофен-2-ілметил)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он.
15. Сполука за п. 1, де сполука формули I являє собою 5-фтор-4-іміно-3-(тридейтеріометил)-1H-піримідин-2-он.

15

---

Комп'ютерна верстка О. Гергіль

---

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

---

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601